

日 本 国 特 許 庁  
JAPAN PATENT OFFICE

別紙添付の書類に記載されている事項は下記の出願書類に記載されている事項と同一であることを証明する。

This is to certify that the annexed is a true copy of the following application as filed with this Office.

出 願 年 月 日                      2 0 0 3 年 1 0 月 3 1 日  
Date of Application:

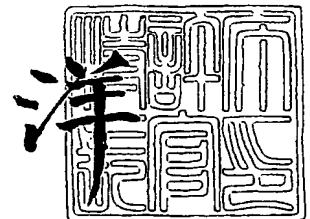
出 願 番 号                      特 願 2 0 0 3 - 3 7 3 2 0 6  
Application Number:  
[ST. 10/C] :                      [ J P 2 0 0 3 - 3 7 3 2 0 6 ]

出      願      人                      大 塚 製 薬 株 式 会 社  
Applicant(s):

2 0 0 5 年    1 月 1 4 日

特許庁長官  
Commissioner,  
Japan Patent Office

小 川



【書類名】 特許願  
【整理番号】 6592003JP  
【提出日】 平成15年10月31日  
【あて先】 特許庁長官殿  
【国際特許分類】 C07D265/30  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市城東町一丁目2-35  
    【氏名】 壺内 英継  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県板野郡北島町北村字三町地33-5  
    【氏名】 佐々木 博文  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市名東町三丁目89-4  
    【氏名】 糸谷 元宏  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市川内町加賀須野463-30今切寮E-312  
    【氏名】 原口 佳和  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県板野郡松茂町広島字北川向二ノ越147-13  
    【氏名】 宮村 伸  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県鳴門市鳴門町高島北字418  
    【氏名】 松本 真  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県鳴門市撫養町南浜字東浜527-1ダイアパレス鳴門1401  
    【氏名】 橋詰 博之  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市川内町沖島422-1グラン川内タワー310  
    【氏名】 富重 辰夫  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市北田宮2丁目9-6-306  
    【氏名】 川崎 昌則  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市川内町沖島244-1 1304号  
    【氏名】 大黒 絹枝  
【発明者】  
    【住所又は居所】 徳島県徳島市東新町2丁目20番地704  
    【氏名】 住田 卓美  
【特許出願人】  
    【識別番号】 000206956  
    【氏名又は名称】 大塚製薬株式会社  
【代理人】  
    【識別番号】 100065215  
    【弁理士】  
    【氏名又は名称】 三枝 英二  
    【電話番号】 06-6203-0941

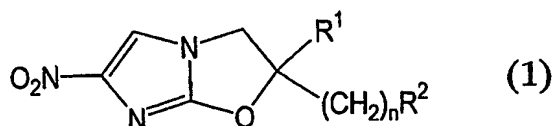
【選任した代理人】  
【識別番号】 100076510  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 掛樋 悠路  
【選任した代理人】  
【識別番号】 100086427  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 小原 健志  
【選任した代理人】  
【識別番号】 100099988  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 斎藤 健治  
【選任した代理人】  
【識別番号】 100105821  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 藤井 淳  
【選任した代理人】  
【識別番号】 100099911  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 関 仁士  
【選任した代理人】  
【識別番号】 100108084  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 中野 睦子  
【手数料の表示】  
【予納台帳番号】 001616  
【納付金額】 21,000円  
【提出物件の目録】  
【物件名】 特許請求の範囲 1  
【物件名】 明細書 1  
【物件名】 要約書 1  
【包括委任状番号】 0313039

## 【書類名】 特許請求の範囲

## 【請求項 1】

一般式 (1)

【化 1】

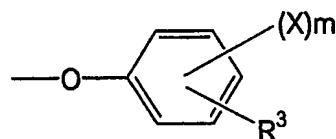


[式中、R¹は、水素原子又はC 1～6 アルキル基を示す。

nは、0～6の整数を示す。

R²は、ベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕が置換していてもよい）；キノリルオキシ基（キノリン環上には、ピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕及びピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基（アミノ基上には、フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；ピリジルオキシ基（ピリジン環上には、少なくとも1個のピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕が置換していてもよい）又は基

【化 2】



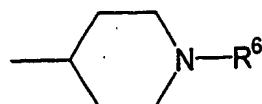
を示す。

ここで、Xはハロゲン原子又は置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6 アルキル基を示す。mは0～3の整数を示す。R³は、

(i) 基—(W) o—NR⁴R⁵

(Wは、基—CO—又はC 1～6 アルキレン基を示す。oは0又は1を示す。R⁴は、水素原子又はC 1～6 アルキル基を示す。R⁵は、基

【化 3】

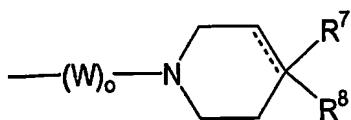


[R⁶は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群

より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC1~6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ベンゾフリルC1~6アルキル基 (ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい) ; フェノキシC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; チアゾリルC1~6アルキル基 (チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) ; フェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; C1~6アルコキシカルボニル基 ; ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 又はフェニルC2~6アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) ;

(ii) 基

【化4】



(W及び<sub>0</sub>は、前記に同じ。R<sup>7</sup>は、水素原子、水酸基、C1~6アルコキシ基又はフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲンが置換していてもよい] を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときはR<sup>7</sup>のみが置換するものとする。

R<sup>8</sup>は、

(1) フェニルC1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基およびハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(2) フェニルC1~6アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(3) フェニルC2~6アルケニルオキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

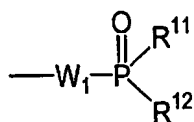
(4) 基 - (W) <sub>0</sub> - NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>

[W及び<sub>0</sub>は前記に同じ。

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は、同一又は異なって、水素原子 ; 置換基として水酸基を有することのあるC1~6アルキル基 ; C1~6アルカノイル基 ; C1~6アルコキシカルボニル基 ; フェニルC1~6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) ;

らなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基、置換基として C 1 ~ 6 アルカノイル基及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C 1 ~ 6 アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも 1 個置換していてもよい) 、C 1 ~ 6 アルキルスルホニル基、C 3 ~ 8 シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C 1 ~ 6 アルキルチオ基、フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) 、水酸基置換 C 1 ~ 6 アルキル基及び基

## 【化 5】



(W<sub>1</sub>は C 1 ~ 6 アルキレン基を示す。R<sup>11</sup>及び R<sup>12</sup>は、同一又は異なって、C 1 ~ 6 アルコキシ基を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェニル C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、置換基として C 1 ~ 4 アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基及び C 1 ~ 4 アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェニル C 2 ~ 6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; C 1 ~ 6 アルコキシ置換 C 1 ~ 6 アルキル基; C 2 ~ 6 アルケニル基; C 1 ~ 6 アルコキシ置換 C 2 ~ 6 アルカノイル基; C 3 ~ 8 シクロアルキル置換 C 1 ~ 6 アルキル基; フェノキシ C 1 ~ 6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1 ~ 6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; ピリジル基; ピリジル C 1 ~ 6 アルキル基; イミダゾリル C 1 ~ 6 アルキル基; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基及び C 1 ~ 6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。) ; キノリル基; インドリル基; 置換基として C 1 ~ 6 アルキル基を有することのあるアミノ基; インダゾリル基; ナフチル基; C 3 ~ 8 シクロアルキル基; 置換基として C 1 ~ 6 アルキル基を有することのあるアミノ置換 C 1 ~ 6 アルキル基; シアノ置換 C 1 ~ 6 アルキル基; フリル置換 C 1 ~ 6 アルキル基又はピペラジニル置換 C 1 ~ 6 アルキル基 (ピペラジン環上には、置換基として少なくとも 1 個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置

換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい)を示す。

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基、イソインドリル基又は5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基、フェニル基〔フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ベンゾイル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ピリジルC 1～6 アルキル基、C 3～8 シクロアルキル基、フェニルC 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、C 1～4 アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ピペリジルC 1～6 アルキル基、ピペリジル基、フェニルC 1～6 アルコキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、C 1～6 アルキル基及びフェニルC 1～6 アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)] ；

(5) フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

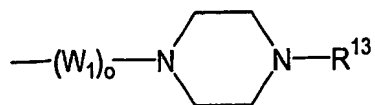
(6) カルバモイルオキシ基 (アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；

(7) カルバモイルオキシ置換C 1～6 アルキル基 (アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ；又は

(8) フェノキシC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。] ；

(iii) 基

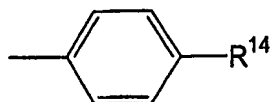
## 【化6】



( $W_1$ 及び $o$ は前記に同じ。 $R^{13}$ は、フェニルC 2～6アルケニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、フェノキシC 1～6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、ベンゾフリル置換C 1～6アルキル基〔ベンゾフラン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕、ベンゾチエニル置換C 1～6アルキル基〔ベンゾチオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子を有していてもよい〕、ナフチル置換C 1～6アルキル基、ピリジル置換C 1～6アルキル基〔ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕、フリル置換C 1～6アルキル基〔フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい〕、チエニル置換C 1～6アルキル基〔チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕、チアゾリル置換C 1～6アルキル基〔チアゾール環上には、C 1～6アルキル基及びフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、テトラゾリル置換C 1～6アルキル基〔テトラゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい〕、イソオキサゾリル置換C 1～6アルキル基〔イソオキサゾール環上には、少なくとも1個のC 1～6アルキル基が置換していてもよい〕、1, 2, 4-オキサジアゾリル置換C 1～6アルキル基〔1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基（フェニル環上には、C 1～6のアルキル基が置換していてもよい）が置換していてもよい〕又はベンゾフラザニル置換C 1～6アルキル基を示す。〕；

(iv) 基

## 【化7】

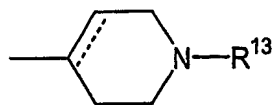


( $R^{14}$ は、フェニルアミノ基〔フェニルアミノ基のN位にはC 1～6アルキル基が置換していてもよく、フェニルアミノ基のフェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が置換していてもよい〕、ピペリジル基〔ピペリジン環上には、フェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が置換していてもよい）及びアミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC 1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕又はフェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基（フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕を示す。)

又は



(v) 基  
【化 8】



(R<sup>13</sup>は前記に同じ。点線は二重結合であってもよいことを示す。)  
を示す。]

で表される 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、  
それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩。

## 【書類名】明細書

【発明の名称】2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物

## 【技術分野】

## 【0001】

本発明は、2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物に関する。

## 【背景技術】

## 【0002】

抗酸菌の中で、ヒト結核菌 (*Mycobacterium tuberculosis*) が広く知られており、人類の3分の1に感染しているといわれる。また、*Mycobacterium africanum* 及び *Mycobacterium bovis* が、ヒト結核菌と同様に結核菌群として知られ、ヒトに対して強い病原性を有するマイコバクテリアとして知られている。

## 【0003】

これらの結核症に対しては、ファーストラインの薬として位置づけされているリファンピシン、イソニアジド及びエタンブトール (又はストレプトマイシン) の3剤、或いはこれらにピラジナミドを加えた4剤を用いた治療が施されている。

## 【0004】

しかしながら、結核症の治療には極めて長期に及ぶ服薬が必要であるため、コンプライアンスが悪くなり、治療に失敗することも稀ではない。

## 【0005】

また、リファンピシンには、肝障害、フルシンドローム、薬物アレルギー、P450関連の酵素誘導による他剤との併用禁忌、イソニアジドには末梢神経障害、リファンピシンとの併用で重篤な肝障害を誘発、エタンブトールには視神経障害による視力低下、ストレプトマイシンには第8脳神経障害による聴力の低下、ピラジナミドには肝障害、尿酸値上昇に伴う痛風発作、嘔吐等の副作用が報告されている (A Clinician's Guide To Tuberculosis, Michael D. Iseman 2000 by Lippincott Williams & Wilkins, printed in the USA, ISBN 0-7817-1749-3, 結核第2版, 久世文幸、泉 孝英、医学書院1992年)。

## 【0006】

実際にこれらの副作用により標準の化学療法が実施できないケースが、全体 (調査対象となった全入院患者228症例) の服薬中止症例 (約23%、52症例) の70%を占めているという報告もある (Kekkaku Vol.74: 77-82, 1999)。

## 【0007】

特に上記ファーストラインで併用使用されている5薬剤の内、リファンピシン、イソニアジド及びピラジナミドに共通する肝毒性は、最も頻発する副作用として知られている。また一方で、抗結核剤に耐性を示す結核菌、多剤耐性となった結核菌等が増加しており、治療を更に困難にしている。

## 【0008】

WHOの調査 (1996年~1999年) によると、世界で分離される結核菌の内、既存抗結核剤のどれかに耐性を示す割合は、19%に達し、多剤耐性結核菌も5.1%と発表されている。このような多剤耐性結核菌に感染している保菌者は、世界で6千万人に達しているであろうといわれており、今後益々多剤耐性結核菌の増加が懸念されている (April 2001 as a supplement to the journal Tuberculosis, the "Scientific Blueprint for TB Drug Development")。

## 【0009】

更には、AIDS患者の死亡原因の大半が結核であり、1997年の時点で結核とHIVに混合感染しているヒトは1070万人に達していると報告されている (Global Alliance for TB drug development)。また、混合感染により、通常より少なくとも30倍高い結核への発症リスクを伴うと考えられている。

## 【0010】

このような現状を踏まえ、望まれる抗結核剤のプロファイルとして、(1) 多剤耐性結核菌にも有効なもの、(2) 短期化学療法を可能にするもの、(3) 副作用の少ないもの

、(4) 潜伏感染している結核菌 (Latent 結核菌) に効力を示すもの、(5) 経口投与可能なもの、等が挙げられる。

【0011】

また、近年増加してきている MAC 症 (Mycobacterium avium-intracellulare complex 症) の原因菌である Mycobacterium avium や Mycobacterium intracellulare、また、その他 Mycobacterium kansasii、Mycobacterium marinum、Mycobacterium simiae、Mycobacterium scrofulaceum、Mycobacterium szulgai、Mycobacterium xenopi、Mycobacterium mageritense、Mycobacterium haemophilum、Mycobacterium ulcerans、Mycobacterium goodii、Mycobacterium fortuitum、Mycobacterium chelonae、Mycobacterium smegmatis、Mycobacterium aurum 等の非定型抗酸菌が、ヒトに病原性を有する菌として知られている。

【0012】

今日、これらの非定型抗酸菌症に対して有望な治療薬は乏しく、抗結核剤であるリファンピシン、イソニアジド、エタンブトール、ストレプトマイシン、カナマイシン、一般細菌感染症治療薬であるニューキノロン剤、マクロライド系抗菌剤、アミノ配糖体系抗菌剤及びテトラサイクリン系抗菌剤が組み合わせて使用されているのが現状である。

【0013】

しかしながら、非定型抗酸菌症の治療には、一般細菌による感染症に比較し、長期の服薬が強いられ、難治化し、死亡する症例も報告されている。このような現状を解決するために、より強い効力を示す薬剤の開発が望まれている。

【0014】

例えば、特表平 11-508270 号公報 (WO 97/01562、特許文献 1) に、6-ニトロ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ [2, 1-b] イミダゾピラン化合物が、インビトロにおいて結核菌 (H37Rv 株) 及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用を有していること及び結核感染動物モデルに対して経口投与で治療効果を有していることから、抗結核剤として有用であることが開示されている。

【0015】

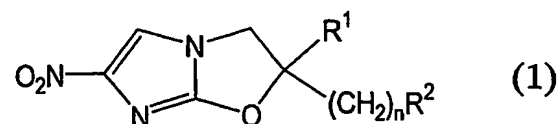
しかしながら、上記文献に記載されている化合物は、本発明化合物とは基本的な骨格が異なり、非類似の化合物である。

【0016】

更に、クプスワミーナガラジャン (Kuppsuwamy Nagarajan) 等は、ヨーロッパジャーナル オブ メディシナル ケミストリー、1989 年、第 24 巻、第 631~633 頁 (European Journal of Medicinal Chemistry 1989, Vol.24, p631-633) (非特許文献 1) に、一般式 (1)

【0017】

【化 1】



【0018】

において、 $R^1$  が水素原子又はメチル基を示し、 $-(CH_2)_n R^2$  がクロロメチル基、 $C_1 \sim C_7$  のアルキル基、イソプロポキシメチル基、3-プロペニルオキシメチル基、無置換のフェノキシメチル基を示す化合物並びに  $R^1$  及び  $-(CH_2)_n R^2$  が結合してシクロペンタン環又はシクロヘキサン環を形成した化合物 (計 16 種類の化合物) が結核菌 (H37Rv 株) に対して、殺菌作用を有することを報告している。

【0019】

しかしながら、上記文献には、経口投与で有効な化合物は僅かに 4 種類だけであり、その中で最も活性の高い化合物、即ち一般式 (1) において  $R^1$  が水素原子を示し、 $-(C$

H<sub>2</sub>)<sub>n</sub>R<sup>2</sup>がエチルである化合物(CGI-17341)に変異原性が見つかったため、これら一連の化合物群の薬剤としての開発を断念したとの記載がある。

【0020】

更に、アンティマイクロバイアル エージェント アンド ケモセラピー、1993年2月号、第183～186頁(Dilip R. Astekar et. Al., Antimicrobial Agents and Chemotherapy, Feb. 1993, p183-186) (非特許文献2)には、上記CGI-17341の抗菌プロファイル、即ち、結核菌(H37Rv株)及び多剤耐性結核菌に対して殺菌作用を有しているものの、非定型抗酸菌属の *M. avium*、*M. intracellulare* 及び *M. fortuitum* に対しては250 µg/ml以下では活性を有していないことが報告されている。

【特許文献1】WO97/01562

【非特許文献1】ヨーロピアン ジャーナル オブ メディシナル ケミストリー、1989年、第24巻、第631～633頁

【非特許文献2】アンティマイクロバイアル エージェント アンド ケモセラピー、1993年2月号、第183～186頁

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0021】

本発明は、結核菌及び多剤耐性結核菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを課題とする。

【0022】

本発明は、非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを課題とする。

【課題を解決するための手段】

【0023】

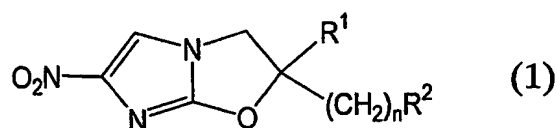
本発明者は、上記課題を解決すべく鋭意研究を重ねた結果、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する新規2, 3-ジヒドロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物の合成に成功した。本発明は、斯かる知見に基づき完成されたものである。

【0024】

本発明は、  
一般式(1)

【0025】

【化2】



【0026】

[式中、R<sup>1</sup>は、水素原子又はC1～6アルキル基を示す。

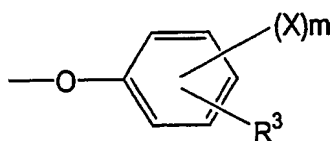
nは、0～6の整数を示す。

R<sup>2</sup>は、ベンゾチアゾリルオキシ基(ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のピペラジニル基[ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]が置換していてもよい)；キノリルオキシ基(キノリン環上には、ピペラジニル基[ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]及びピペリジ

ル基 [ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のアミノ基 (アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; ピリジルオキシ基 (ピリジン環上には、少なくとも 1 個のピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも 1 個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) が置換していてもよい] が置換していてもよい) 又は基

【0027】

【化3】



【0028】

を示す。

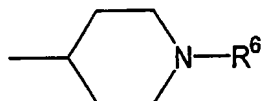
ここで、X はハロゲン原子又は置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換 C 1～6 アルキル基を示す。m は 0～3 の整数を示す。R<sup>3</sup> は、

(i) 基—(W) o—NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>

(W は、基—CO—又は C 1～6 アルキレン基を示す。o は 0 又は 1 を示す。R<sup>4</sup> は、水素原子又は C 1～6 アルキル基を示す。R<sup>5</sup> は、基

【0029】

【化4】



【0030】

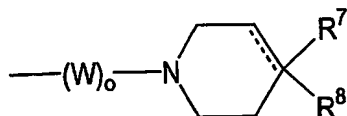
[R<sup>6</sup> は、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; ベンゾフリル C 1～6 アルキル基 (ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい) ; フェノキシ C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; チアゾリル C 1～6 アルキル基 (チアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] が置換していてもよい) ; フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; C 1～6 アルコキシカルボニル基; ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換も

くは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 又はフェニルC 2～6アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) を示す。) ;

(ii) 基

【0031】

【化5】



【0032】

(W及びoは、前記に同じ。R<sup>7</sup>は、水素原子、水酸基、C 1～6アルコキシ基又はフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲンが置換していてもよい] を示す。点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合を示すときはR<sup>7</sup>のみが置換するものとする。

R<sup>8</sup>は、

(1) フェニルC 1～6アルコキシ置換C 1～6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基およびハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(2) フェニルC 1～6アルコキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

(3) フェニルC 2～6アルケニルオキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ;

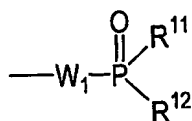
(4) 基—(W) o—NR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>

[W及びoは前記に同じ。

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は、同一又は異なって、水素原子; 置換基として水酸基を有することのあるC 1～6アルキル基; C 1～6アルカノイル基; C 1～6アルコキシカルボニル基; フェニルC 1～6アルコキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基、置換基としてC 1～6アルカノイル基及びC 1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C 1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい) 、C 1～6アルキルスルホニル基、C 3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C 1～6アルキルチオ基、フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) 、水酸基置換C 1～6アルキル基及び基

【0033】

## 【化6】



## 【0034】

(W<sub>1</sub>はC 1～6 アルキレン基を示す。R<sup>11</sup>及びR<sup>12</sup>は、同一又は異なって、C 1～6 アルコキシ基を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、置換基としてC 1～4 アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基及びC 1～4 アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルC 2～6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; C 1～6 アルコキシ置換C 1～6 アルキル基; C 2～6 アルケニル基; C 1～6 アルコキシ置換C 2～6 アルカノイル基; C 3～8 シクロアルキル置換C 1～6 アルキル基; フェノキシC 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; フェニルカルバモイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) ; ピリジル基; ピリジルC 1～6 アルキル基; イミダゾリルC 1～6 アルキル基; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基及びC 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。) ; キノリル基; インドリル基; 置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ基; インダゾリル基; ナフチル基; C 3～8 シクロアルキル基; 置換基としてC 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換C 1～6 アルキル基; シアノ置換C 1～6 アルキル基; フリル置換C 1～6 アルキル基又はピペラジニル置換C 1～6 アルキル基 (ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] が置換していてもよい) を示す。

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して1, 2, 3, 4-テトラヒドロイソキノリル基、イソインドリル基又は5～7員の飽和複素環を形成してもよい。該複素環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基、フェニル基 [フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ベンゾイル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6 アルキル基及びハロ

ゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、ピリジル C 1～6 アルキル基、C 3～8 シクロアルキル基、フェニル C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、C 1～4 アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、ピペリジル C 1～6 アルキル基、ピペリジル基、フェニル C 1～6 アルコキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、フェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、置換基としてフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、C 1～6 アルキル基及びフェニル C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。) ] ;

(5) フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

(6) カルバモイルオキシ基 (アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ;

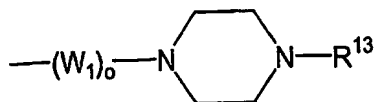
(7) カルバモイルオキシ置換 C 1～6 アルキル基 (アミノ基上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) ; 又は

(8) フェノキシ C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) を示す。] ;

(iii) 基

【0035】

【化7】



【0036】

( $W_1$ 及び $0$ は前記に同じ。 $R^{13}$ は、フェニル C 2～6 アルケニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、フェノキシ C 1～6 アルキル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]

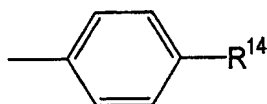


、ベンゾフリル置換 C 1～6 アルキル基 [ベンゾフラン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい]、ベンゾチエニル置換 C 1～6 アルキル基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子を有していてもよい]、ナフチル置換 C 1～6 アルキル基、ピリジル置換 C 1～6 アルキル基 [ピリジン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい]、フリル置換 C 1～6 アルキル基 [フラン環上には、少なくとも 1 個のニトロ基が置換していてもよい]、チエニル置換 C 1～6 アルキル基 [チオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい]、チアゾリル置換 C 1～6 アルキル基 [チアゾール環上には、C 1～6 アルキル基及びフェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい]、テトラゾリル置換 C 1～6 アルキル基 [テトラゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1～6 アルキル基が置換していてもよい]、イソオキサゾリル置換 C 1～6 アルキル基 [イソオキサゾール環上には、少なくとも 1 個の C 1～6 アルキル基が置換していてもよい]、1, 2, 4-オキサジアゾリル置換 C 1～6 アルキル基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基 (フェニル環上には、C 1～6 のアルキル基が置換していてもよい) が置換していてもよい] 又はベンゾフラザニル置換 C 1～6 アルキル基を示す。} ;

(iv) 基

【0037】

【化8】



【0038】

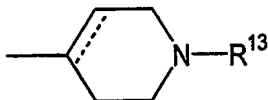
(R<sup>14</sup>は、フェニルアミノ基 [フェニルアミノ基のN位にはC 1～6 アルキル基が置換していてもよく、フェニルアミノ基のフェニル環上には、少なくとも 1 個のハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい]、ピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい) 及びアミノ基 (該アミノ基上には、置換基として C 1～6 アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換 C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] 又はフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基 (フェニル環上には、少なくとも 1 個のハロゲン置換もしくは未置換の C 1～6 アルコキシ基が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] を示す。)

又は

(v) 基

【0039】

【化9】



【0040】

(R<sup>13</sup>は前記に同じ。点線は二重結合であってもよいことを示す。)

を示す。]

で表される2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2, 1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理的に許容される塩を提供する。

【0041】

本明細書において、 $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 等で示される各基は、具体的に次の通りである。

【0042】

ハロゲン原子としては、フッ素原子、塩素原子、臭素原子及びヨウ素原子を示す。

【0043】

C1~6アルキル基とは、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、*n*-プロピル基、イソプロピル基、*n*-ブチル基、イソブチル基、*tert*-ブチル基、*sec*-ブチル基、*n*-ペンチル基、ネオペンチル基、*n*-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基等を挙げることができる。

【0044】

C1~6アルコキシ基とは、上記定義されたC1~6アルキル基と酸素原子で構成される基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、*n*-プロポキシ基、イソプロポキシ基、*n*-ブトキシ基、イソブトキシ基、*tert*-ブトキシ基、*sec*-ブトキシ基、*n*-ペントキシ基、ネオペントキシ基、*n*-ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、3-メチルペントキシ基等を挙げることができる。

【0045】

フェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された基が1~5個、好ましくは1~3個置換している基であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-*n*-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-*n*-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-

トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0046】

ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基とは、上記定義された炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキル基及びハロゲン原子が1~7個置換した前記アルキル基であって、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、tert-ブチル基、sec-ブチル基、n-ペンチル基、ネオペンチル基、n-ヘキシル基、イソヘキシル基、3-メチルペンチル基、フルオロメチル基、ジフルオロメチル基、トリフルオロメチル基、クロロメチル基、ジクロロメチル基、トリクロロメチル基、プロモメチル基、ジプロモメチル基、ジクロロフルオロメチル基、2, 2, 2-トリフルオロエチル基、ペンタフルオロエチル基、2-クロロエチル基、3, 3, 3-トリフルオロプロピル基、ヘプタフルオロプロピル基、ヘプタフルオロイソプロピル基、3-クロロプロピル基、2-クロロプロピル基、3-プロモプロピル基、4, 4, 4-トリフルオロブチル基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブチル基、4-クロロブチル基、4-プロモブチル基、2-クロロブチル基、5, 5, 5-トリフルオロペンチル基、5-クロロペンチル基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシル基、6-クロロヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0047】

ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基とは、上記で定義されたC1~6のアルコキシ基及びハロゲン原子が1~7個置換した前記アルコキシ基であって、例えば、メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、tert-ブトキシ基、sec-ブトキシ基、n-ペントキシ基、ネオペントキシ基、n-ヘキシルオキシ基、イソヘキシルオキシ基、3-メチルペントキシ基、フルオロメトキシ基、ジフルオロメトキシ基、トリフルオロメトキシ基、クロロメトキシ基、ジクロロメトキシ基、トリクロロメトキシ基、プロモメトキシ基、ジプロモメトキシ基、ジクロロフルオロメトキシ基、2, 2, 2-トリフルオロエトキシ基、ペンタフルオロエトキシ基、2-クロロエトキシ基、3, 3, 3-トリフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロプロポキシ基、ヘプタフルオロイソプロポキシ基、3-クロロプロポキシ基、2-クロロプロポキシ基、3-プロモプロポキシ基、4, 4, 4-トリフルオロブトキシ基、4, 4, 4, 3, 3-ペンタフルオロブトキシ基、4-クロロブトキシ基、4-プロモブトキシ基、2-クロロブトキシ基、5, 5, 5-トリフルオロペントキシ基、5-クロ

ロペントキシ基、6, 6, 6-トリフルオロヘキシルオキシ基、6-クロロヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

【0048】

ベンゾチアゾリルオキシ基（ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のピペラジニル基〔ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）が置換していてもよい〕が置換していてもよい）としては、例えば、2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-（1-ピペラジニル）-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-（4-ベンジル-1-ピペラジニル）-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-（3, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル）-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-（2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペラジニル）-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（2-フェネチル）-1-ピペラジニル〕-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（3-フェニルプロピル）-1-ピペラジニル〕-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（4-フェニルブチル）-1-ピペラジニル〕-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（5-フェニルペンチル）-1-ピペラジニル〕-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（6-フェニルヘキシル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（2-フルオロベンジル）-1-ピペラジニル〕-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（3-フルオロベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（4-フルオロベンジル）-1-ピペラジニル〕-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（2-クロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（3-クロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-〔4-（4-クロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-〔4-（2, 3-ジクロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-〔4-（2, 4-ジクロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（3, 4-ジクロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（3, 5-ジクロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（3, 4, 5-トリクロロベンジル）-1-ピペラジニル〕-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル）-1-ピペラジニル〕-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（2-トリフルオロメチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（3-トリフルオロメチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、2-〔4-（4-トリフルオロメチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-〔4-（4-メチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-〔4-（3, 4-ジメチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-〔4-（2, 4, 6-トリメチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（2-ペンタフルオロエチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（3-ペンタフルオロエチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（4-ペンタフルオロエチルベンジル）-1-ピペラジニル〕-6-ベンゾチアゾリルオキシ基、4-〔4-（2-トリフルオロメトキシベンジル）-1-ピペラジニル〕-7-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-〔4-（3-トリフルオロメトキシベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-〔4-（4-トリフルオロメトキシベンジル）-1-ピペラジニル〕-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-〔4-（4-メトキシベンジル）-1-ピペラジニル〕-5-ベンゾチアゾリルオキシ基、6-〔4-（3, 4-ジメトキシベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、7-〔4-（2, 4, 6-トリメトキシベンジル）-1-ピペラジニル〕-4-ベンゾチアゾリルオキシ基、5-〔4-（

2-ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] - 4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- [4- (3-ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6- [4- (4-ペンタフルオロエトキシベンジル) - 1-ピペラジニル] - 4-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- {4- [2- (4-トリフルオロメトキシフェニル) エチル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- {4- [3- (4-トリフルオロメトキシフェニル) プロピル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- {4- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル) プチル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- {4- [5- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ペンチル] - 1-ピペラジニル} - 3-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- {4- [6- (4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル] - 1-ピペラジニル} - 3-ベンゾチアゾリルオキシ基、4- {4- [2- (4-トリフルオロメチルフェニル) エチル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5- {4- [3- (4-トリフルオロメチルフェニル) プロピル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、6- {4- [4- (4-トリフルオロメチルフェニル) プチル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、7- {4- [5- (4-トリフルオロメチルフェニル) ペンチル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基、5- {4- [6- (4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシル] - 1-ピペラジニル} - 2-ベンゾチアゾリルオキシ基等のベンゾチアゾリルオキシ基 (ベンゾチアゾール環上には、少なくとも1個のピペラジニル基 [ピペラジン環上には、フェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) が1~3個置換していてもよい] が置換していてもよい) 等を挙げることができる。

#### 【0049】

フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] とは、無置換のフェニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニル基であって、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-プロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メ

チル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

#### 【0050】

ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、1-ピペラジニル基、2-ピペラジニル基、3, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル基、2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペラジニル基、4-ベンジル-1-ピペラジニル基、4-(2-フェネチル)-1-ピペラジニル基、4-(3-フェニルプロピル)-1-ピペラジニル基、4-(4-フェニルブチル)-1-ピペラジニル基、4-(5-フェニルペンチル)-1-ピペラジニル基、4-(6-フェニルヘキシル)-1-ピペラジニル基、4-(2-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-フルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-クロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-クロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-クロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 3-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 5-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル基等を挙げる。

ラジニル基、4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-メトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3,4-ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2,4,6-トリメトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル]-1-ピペラジニル基、4-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル基、4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル基、4-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル]-1-ピペラジニル基、4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-1-ピペラジニル基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル基、4-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル基、4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-1-ピペラジニル基等のピペラジニル基[ピペラジン環上には、1~3個のフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい]を挙げることができる。

#### 【0051】

ピペリジル基[ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基(該アミノ基上には、フェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい]としては、例えば、1-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2,4-ジアミノ-1-ピペリジル基、2,4,6-トリアミノ-1-ピペリジル基、2-アミノ-1-ピペリジル基、3-アミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-1-ピペリジル基、4-メチルアミノ-1-ピペリジル基、4-エチルアミノ-1-ピペリジル基、4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジー-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-フェニルアミノ-1-ピペリジル基、4-(N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-クロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2,3-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2,4,6-トリフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(3,4-ジクロロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2,3-ジメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-1-ピペリジル基、4-(2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ)-1-

ーピペリジル基、4- (3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (4-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (2-メトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (2, 3-ジメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- [N-メチル-N- (2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)] -1-ピペリジル基、4- [N-メチル-N- (3, 4, -ジメチルフェニルアミノ)] -1-ピペリジル基、4- (3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (2-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (3-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル基、4- (4-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル基等のピペリジル基 [ピペリジン環上には、1~3個のアミノ基 (該アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] 及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基1~2個置換していてもよい) が置換していてもよい] を挙げることができる。

#### 【0052】

キノリルオキシ基 (キノリン環上には、ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、少なくとも1個のフェニルC1~6アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のアミノ基 (該アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] 及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] なる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、2-キノリルオキシ基、3-キノリルオキシ基、4-キノリルオキシ基、5-キノリルオキシ基、6-キノリルオキシ基、7-キノリルオキシ基、8-キノリルオキシ基、4- (1-ピペラジニル) -2-キノリルオキシ基、3- (2-ピペラジニル) -4-キノリルオキシ基、4- (1-ピペラジニル) -3-キノリルオキシ基、5- (1-ピペラジニル) -4-キノリルオキシ基、6- (3, 4-ジベンジル-1-ピペラジニル) -5-キノリルオキシ基、7- (2, 3, 4-トリベンジル-1-ピペラジニル) -6-キノリルオキシ基、4- (4-ベンジル-1-ピペラジニル) -2-キノリルオキシ基、3- [4- (2-フェネチル) -1-ピペラジニル] -2-キノリルオキシ基、4- [4- (3-フェニルプロピル) -1-ピペラジニル] -3-キノリルオキシ基、5- [4- (4-フェニルブチル) -1-ピペラジニル] -4-キノリルオキシ基、6- [4- (5-フェニルペンチル) -1-ピペラジニル] -5-キノリルオキシ基、7- [4- (6-フェニルヘキシル) -1-ピペラジニル] -6-キノリルオキシ基、8- [4- (2-フルオロベンジル) -1-ピペラジニル] -7-キノリルオキシ基、2- [4- (3-フルオロベンジル) -1-ピペラジニル] -8-キノリルオキシ基、3- [4- (4-フルオロベンジル) -1-ピペラジニル] -2-キノリルオキシ基、4- [4- (2-クロロベンジル) -1-ピペラジニル] -3-キノリルオキシ基、5- [4- (3-クロロベンジル) -1-ピペラジニル] -4-キノリルオキシ基、6- [4- (4-クロロベンジル) -1-ピペラジニル] -5-キノリルオキシ基、7- [4- (2, 3-ジクロロベンジル) -1-ピペラジニル] -6-キノリルオキシ基、8- [4- (2, 4-ジクロロベンジル) -1-ピペラジニル] -7-キノリルオキシ基、2- [4- (3, 4-ジクロロベンジル) -1-ピペラジニル]



-8-キノリルオキシ基、3-[4-(3, 5-ジクロロベンジル)-1-ピペラジニル]  
 ]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(3, 4, 5-トリクロロベンジル)-1-ピペ  
 ラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロ  
 ベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2-トリフルオ  
 ロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、7-[4-(3-ト  
 リフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-  
 (4-トリフルオロメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-7-キノリルオキシ基、2  
 -[4-(4-メチルベンジル)-1-ピペラジニル]-8-キノリルオキシ基、3-[  
 4-(3, 4-ジメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-  
 [4-(2, 4, 6-トリメチルベンジル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ  
 基、5-[4-(2-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノ  
 リルオキシ基、6-[4-(3-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペラジニル]  
 -5-キノリルオキシ基、7-[4-(4-ペンタフルオロエチルベンジル)-1-ピペ  
 ラジニル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-(2-トリフルオロメトキシベンジル)  
 -1-ピペラジニル]-7-キノリルオキシ基、2-[4-(3-トリフルオロメトキシ  
 ベンジル)-1-ピペラジニル]-8-キノリルオキシ基、3-[4-(4-トリフルオ  
 ロメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-(4-  
 メトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-(3, 4  
 -ジメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ基、6-[4-(2  
 , 4, 6-トリメトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-5-キノリルオキシ基、7-  
 [4-(2-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-6-キノリルオ  
 キシ基、8-[4-(3-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラジニル]-2  
 -キノリルオキシ基、3-[4-(4-ペンタフルオロエトキシベンジル)-1-ピペラ  
 ジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニ  
 ル)エチル]-1-ピペラジニル]-3-キノリルオキシ基、5-[4-[3-(4-トリ  
 フルオロメトキシフェニル)プロピル]-1-ピペラジニル]-4-キノリルオキシ  
 基、6-[4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル]  
 ]-5-キノリルオキシ基、7-[4-[5-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペ  
 ンチル]-1-ピペラジニル]-6-キノリルオキシ基、8-[4-[6-(4-トリフ  
 ルオロメトキシフェニル)ヘキシル]-1-ピペラジニル]-7-キノリルオキシ基、2  
 -[4-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル]-1-ピペラジニル]-8  
 -キノリルオキシ基、3-[4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル]  
 -1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、4-[4-[4-(4-トリフルオロメ  
 チルフェニル)ブチル]-1-ピペラジニル]-2-キノリルオキシ基、5-[4-[5  
 -(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル]-1-ピペラジニル]-2-キノリル  
 オキシ基、6-[4-[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル]-1-ピペ  
 ラジニル]-2-キノリルオキシ基、3-(2-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、  
 4-(3-ピペリジル)-3-キノリルオキシ基、5-(4-ピペリジル)-4-キノリ  
 ルオキシ基、6-(2, 4-ジアミノ-1-ピペリジル)-5-キノリルオキシ基、7-  
 (2, 4, 6-トリアミノ-1-ピペリジル)-6-キノリルオキシ基、8-(4-アミ  
 ノ-1-ピペリジル)-7-キノリルオキシ基、2-(4-アミノ-1-ピペリジル)-  
 8-キノリルオキシ基、3-(4-アミノ-1-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、  
 4-(4-メチルアミノ-1-ピペリジル)-3-キノリルオキシ基、5-(4-エチル  
 アミノ-1-ピペリジル)-4-キノリルオキシ基、6-(4-n-プロピルアミノ-1  
 -ピペリジル)-5-キノリルオキシ基、7-(4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル)  
 -6-キノリルオキシ基、8-(4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル)-7-キノリル  
 オキシ基、2-(4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル)-8-キノリルオキシ  
 基、3-(4-フェニルアミノ-1-ピペリジル)-2-キノリルオキシ基、4-[4-  
 (N-フェニル-N-メチルアミノ)-1-ピペリジル]-3-キノリルオキシ基、5-  
 [4-(2-フルオロフェニルアミノ)-1-ピペリジル]-4-キノリルオキシ基、6

- [4- (3-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -5-キノリルオキシ基、  
 7- [4- (4-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -6-キノリルオキシ基  
 、8- [4- (2-クロロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -7-キノリルオキシ基  
 、2- [4- (3-クロロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -8-キノリルオキシ基  
 、3- [4- (4-クロロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -2-キノリルオキシ基  
 、4- [4- (2, 3-ジクロロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -3-キノリルオ  
 キシ基、5- [4- (2, 4, 6-トリフルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -  
 4-キノリルオキシ基、6- [4- (2, 4-ジクロロフェニルアミノ) -1-ピペリジ  
 ル] -5-キノリルオキシ基、7- [4- (3, 4-ジクロロフェニルアミノ) -1-ピ  
 ペリジル] -6-キノリルオキシ基、8- [4- (3, 5-ジクロロフェニルアミノ) -  
 1-ピペリジル] -7-キノリルオキシ基、2- [4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフ  
 ルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -8-キノリルオキシ基、3- [4- (2-  
 トリフルオロメチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -2-キノリルオキシ基、4-  
 [4- (2-メチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -3-キノリルオキシ基、5-  
 [4- (2, 3-ジメチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -4-キノリルオキシ基  
 、6- [4- (2-トリフルオロメチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -5-キノ  
 リルオキシ基、7- [4- (2, 4, 6-トリメチルフェニルアミノ) -1-ピペリジ  
 ル] -6-キノリルオキシ基、8- [4- (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) -1  
 -ピペリジル] -7-キノリルオキシ基、2- [4- (2-ペンタフルオロエチルフェニ  
 ルアミノ) -1-ピペリジル] -8-キノリルオキシ基、3- [4- (3-ペンタフルオ  
 ロエチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -2-キノリルオキシ基、4- [4- (4-  
 ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) -1-ピペリジル] } -3-キノリルオキシ基  
 、5- [4- (2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -4-キノ  
 リルオキシ基、6- [4- (2-メトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -5-キ  
 ノリルオキシ基、7- [4- (2, 3-ジメトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル  
 ] -6-キノリルオキシ基、8- [4- (2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ) -  
 1-ピペリジル] -7-キノリルオキシ基、2- {4- [N-メチル-N- (2, 4, 6-  
 トリメトキシフェニルアミノ) ] -1-ピペリジル} -8-キノリルオキシ基、3- {  
 4- [N-メチル-N- (3, 4, -ジメチルフェニルアミノ) ] -1-ピペリジル} -  
 2-キノリルオキシ基、4- [4- (3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) -1-  
 ピペリジル] -2-キノリルオキシ基、5- [4- (4-トリフルオロメトキシフェニル  
 アミノ) -1-ピペリジル] -2-キノリルオキシ基、6- [4- (2-ペンタフルオロ  
 エトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -2-キノリルオキシ基、7- [4- (3-  
 ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -2-キノリルオキシ基  
 、8- [4- (4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -2-  
 キノリルオキシ基、2- [4- (2-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -3-  
 キノリルオキシ基、3- [4- (3-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル] -  
 2-キノリルオキシ基、4- [4- (4-フルオロフェニルアミノ) -1-ピペリジル]  
 -2-キノリルオキシ基、2, 4-ジ (1-ピペラジニル) -6-キノリルオキシ基、3-  
 (1-ピペリジル) -4- (1-ピペラジニル) -2-キノリルオキシ基、2, 4, 6-  
 トリ (1-ピペリジニル) -3-キノリルオキシ基等のキノリルオキシ基 (キノリン環  
 上には、ピペラジニル基 [ピペラジン環上には、1~3個のフェニルC1~6アルキル基  
 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及び  
 ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、  
 好ましくは1~3個置換していてもよい) が置換していてもよい] 及びピペリジル基 [ピ  
 ペリジン環上には、1~3個のアミノ基 (該アミノ基上には、フェニル基 [フェニル環上  
 には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又  
 は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~  
 3  
 個置換していてもよい] 及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~2個置

換していてもよい) が置換していてもよい] なる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

#### 【0053】

フェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2,3-ジクロロフェノキシ基、3,4-ジクロロフェノキシ基、2,4-ジクロロフェノキシ基、3,4,5-トリクロロフェノキシ基、2,4,6-トリクロロフェノキシ基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-エチルフェノキシ基、3-エチルフェノキシ基、4-エチルフェノキシ基、4-n-プロピルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2,3-ジメチルフェノキシ基、3,4,5-トリメチルフェノキシ基、4-n-ペンチルフェノキシ基、4-n-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、2-エトキシフェノキシ基、3-エトキシフェノキシ基、4-エトキシフェノキシ基、4-n-プロポキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、3,4,5-トリメトキシフェノキシ基、4-n-ペンチルオキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基等のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) を挙げることができる。

#### 【0054】

ピペリジル基 [ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、1-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-フェノキシ-1-ピペリジル基、2,4-ジフェノキシ-1-ピペリジル基、2,4,6-トリフェノキシ-1-ピペリジル基、2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル基、2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、3-(3-クロロフェノキシ)-5-ピペリジル基、4-(4-クロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、5-(2-ブロモフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(3-ブロモフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-(4-ブロモフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(2,3-ジクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2,4-ジクロロフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3,4,5-トリクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、6-(2,4,6-トリクロロフェノキシ)-2-ピペリジル基、3-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-エチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(3-エチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、4-(4-n-プロピルフェノキシ)

-3-ピペリジル基、3-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル基、1-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(2,3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3,4,5-トリメチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-n-ペンチルフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(3-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、1-(4-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(4-n-プロポキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル基、3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、1-(2,3-ジメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル基、4-(3,4,5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基、4-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル基等のピペリジル基〔ピペリジン環上には、1~3個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい〕を挙げることができる。

#### 【0055】

ピリジルオキシ基(ピリジン環上には、少なくとも1個のピペリジル基〔ピペリジン環上には、少なくとも1個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)が置換していてもよい〕が置換していてもよい。)としては、例えば、2-ピリジルオキシ基、3-ピリジルオキシ基、4-ピリジルオキシ基、3-(1-ピペリジル)-2-ピリジルオキシ基、2-(4-ピペリジル)-3-ピリジルオキシ基、4-(2-ピペリジル)-3-ピリジルオキシ基、5-(3-ピペリジル)-2-ピリジルオキシ基、2,4-ジ(1-ピペリジル)-3-ピリジルオキシ基、2-(1-ピペリジル)-4-[2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、2,4,6-トリ(1-ピペリジル)-3-ピリジルオキシ基、2-(4-フェノキシ-1-ピペリジル)-3-ピリジルオキシ基、2-(2,4-ジフェノキシ-1-ピペリジル)-3-ピリジルオキシ基、3-(2,4,6-トリフェノキシ-1-ピペリジル)-4-ピリジルオキシ基、4-[2-(2-フルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[3-(3-フルオロフェノキシ)-2-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[4-(4-フルオロフェノキシ)-3-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、2-[2-(2-クロロフェノキシ)-4-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、3-[3-(3-クロロフェノキシ)-5-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、4-[4-(4-クロロフェノキシ)-2-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[5-(2-プロモフェノキシ)-2-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[6-(3-プロモフェノキシ)-3-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、2-[4-(4-プロモフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、3-[3-(2,3-ジクロロフェノキシ)-2-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、4-(3,4-ジクロロフェノキシ)-3-ピペリジル基、4-[3-(2,4-ジクロロフェノキシ)-4-ピペリジル]-

2-ピリジルオキシ基、5-[2-(3, 4, 5-トリクロロフェノキシ)-3-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、6-[6-(2, 4, 6-トリクロロフェノキシ)-2-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、2-[3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、4-[4-(2-メチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、3-[5-(3-メチルフェノキシ)-2-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[6-(4-メチルフェノキシ)-3-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[1-(2-エチルフェノキシ)-4-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、2-[2-(3-エチルシフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、3-[3-(4-エチルフェノキシ)-2-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、4-[4-(4-n-プロピルフェノキシ)-3-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[5-(4-tert-ブチルフェノキシ)-4-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[2-(4-n-ブチルフェノキシ)-3-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、2-[1-(2-トリフルオロメチルフェノキシ)-2-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、3-[2-(3-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、4-[3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[1-(2-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[1-(3-ペンタフルオロエチルフェノキシ)-4-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、2-[4-(2, 3-ジメチルフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、3-[1-(3, 4, 5-トリメチルフェノキシ)-4-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、4-[1-(4-n-ペンチルフェノキシ)-4-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、5-[4-(4-n-ヘキシルフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、6-[4-(2-メトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、2-[1-(3-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、3-[1-(4-メトキシフェノキシ)-4-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、4-[2-(2-エトキシフェノキシ)-3-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[3-(3-エトキシフェノキシ)-4-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[4-(4-エトキシフェノキシ)-5-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、2-[3-(4-n-プロポキシフェノキシ)-2-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、3-[2-(4-tert-ブトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-4-ピリジルオキシ基、4-[1-(4-n-ブトキシフェノキシ)-2-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、6-[3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)-3-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、2-[3-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-2-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、3-[4-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、4-[1-(2, 3-ジメトキシフェノキシ)-4-ピペリジル]-2-ピリジルオキシ基、5-[4-(3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、6-[4-(4-n-ペンチルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基、5-[4-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ)-1-ピペリジル]-3-ピリジルオキシ基等のピリジルオキシ基(ピリジン環上には、1~3個のピペリジル基[ピペリジン環上には、1~3個のフェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)が置換していてもよい]が置換していてもよい)を挙げることができる。

#### 【0056】

置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ置換C1~6アルキル基としては、例えば、アミノメチル基、2-アミノエチル基、1-アミノエチル基、3-アミノプロピル基、4-アミノブチル基、5-アミノペンチル基、6-アミノヘキシル基、2-

ーメチルー3-アミノプロピル基、1, 1-ジメチルー2-アミノエチル基、エチルアミノメチル基、1-(プロピルアミノ)エチル基、2-(メチルアミノ)エチル基、3-(イソプロピルアミノ)プロピル基、4-(n-ブチルアミノ)ブチル基、5-(n-ペンチルアミノ)ペンチル基、6-(n-ヘキシルアミノ)ヘキシル基、ジメチルアミノメチル基、(N-エチルーN-プロピルアミノ)メチル基、2-(N-メチルーN-ヘキシルアミノ)エチル基等の置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ-C1~6アルキル基を挙げることができる。

#### 【0057】

C1~6アルキレン基としては、例えば、メチレン、エチレン、トリメチレン、2-メチルトリメチレン、2, 2-ジメチルトリメチレン、1-メチルトリメチレン、メチルメチレン、エチルメチレン、テトラメチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基等を挙げることができる。

#### 【0058】

フェニルC1~6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシルオキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-プロモベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-プロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-(2-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(3-クロロフェニル)エトキシカルボニル基、2-(4-クロロフェ

ニル) エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル) エトキシカルボニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシルオキシカルボニル基等を挙げることができる。

#### 【0059】

ベンゾフリル置換C1~6アルキル基(ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい)としては、例えば、2-ベンゾフリルメチル基、1-(2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-ベンゾフリル)エチル基、3-(5-ベンゾフリル)プロピル基、4-(6-ベンゾフリル)ブチル基、5-(7-ベンゾフリル)ペンチル基、6-(2-ベンゾフリル)ヘキシル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、2-(4-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、2-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、2-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-

(7-クロロ-3-ベンゾフリル) エチル基、2-(4-フルオロ-2-ベンゾフリル) エチル基、6-(5-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(6-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(4-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(5-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(6-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(7-クロロ-2-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル) メチル基、6-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(4-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(5-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(6-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、6-(7-クロロ-3-ベンゾフリル) ヘキシル基、(2, 4-ジプロモ-3-ベンゾフリル) メチル基、(4, 5, 6-トリクロロ-3-ベンゾフリル) メチル基等のベンゾフラン環上にハロゲン原子が1~3個置換していてもよいベンゾフリル置換C1~6アルキル基を挙げることができる。

#### 【0060】

フェノキシC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換のフェノキシ基又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びハロゲンからなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換したフェノキシ基とC1~6アルキル基で構成される基であって、例えば、フェノキシメチル基、2-フェノキシエチル基、3-フェノキシプロピル基、4-フェノキシブチル基、5-フェノキシペンチル基、6-フェノキシヘキシル基、4-フルオロフェノキシメチル基、2-フルオロ-4-プロモフェノキシメチル基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシメチル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシメチル基、3, 4, 5-フェノキシメチル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシメチル基、4-イソプロピルフェノキシメチル基、4-n-ブチルフェノキシメチル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-メチルフェノキシメチル基、3-メチルフェノキシメチル基、2, 4-ジメチルフェノキシメチル基、2, 3-ジメチルフェノキシメチル基、2, 5-ジメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 5-ジメチルフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシメチル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシメチル基、4-イソプロポキシフェノキシメチル基、4-n-ブトキシフェノキシメチル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-メトキシフェノキシメチル基、3-メトキシフェノキシメチル基、2, 4-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 3-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 6-ジメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 5-ジメトキシフェノキシメチル基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシメチル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-イソプロポキシフェノキシメチル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシメチル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシメチル基、4-プロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-フルオロフェノキシ)エチル基、3-(4-フルオロフェノキシ)プロピル基、4-(4-フルオロフェノキシ)ブチル基、5-(4-フルオロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-フルオロフェノキシ)ヘキシル基、4-クロロフェノキシメチル基、2-(4-クロロフェノキシ)エチル基、3-(4-クロロフェノキシ)プロピル基、4-(4-クロロフェノキシ)ブチル基、5-(4-クロロフェノキシ)ペンチル基、6-(4-クロロフェノキシ)ヘキシル基、4-メチルフェノキシメチル基、2-(4-メチルフェノキシ)エチル基、3-(4-メチルフェノキシ)プロピル基、4-(4-メチルフェノキシ)ブチル基、5-(4-メチルフェノキシ)ペンチル基、6-(4-メチルフェノキシ)ヘキシル基、4-トリフルオロメチルフェノキシメチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)エチル基、3-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)プロピル基、4-(4-トリフルオロ



メチルフェノキシ) プチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ペンチル基、6-(4-トリフルオロメチルフェノキシ) ヘキシル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシメチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) プロピル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) プチル基、5-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ペンチル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) ヘキシル基、4-メトキシフェノキシメチル基、2-(4-メトキシフェノキシ) エチル基、3-(4-メトキシフェノキシ) プロピル基、4-(4-メトキシフェノキシ) プチル基、5-(4-メトキシフェノキシ) ペンチル基、6-(4-メトキシフェノキシ) ヘキシル基等を挙げることができる。

# 【0061】

チアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、2-チアゾリルメチル基、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2, 5-ジフェニル-4-チアゾリルメチル基、2, 4-ジフェニル-5-チアゾリルメチル基、5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(3-ヨードフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(3-メチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(3-エチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-プロピルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-n-ブチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-n-ペンチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-n-ヘキシルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、5-(3, 4-ジメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-メトキシフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-エトキシフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-プロポキシフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-n-ブトキシフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリル)エチル基、2-(5-チアゾリル)エチル基、2-[5-(2-n-ペンチルオキシフェニル)-4-チアゾリル]エチル基、2-[2-(2-n-ヘキシルオキシフェニル)-5-チアゾリル]エチル基、2-[2-(2, 5-ジメトキシフェニル)-4-チアゾリル]エチル基、2-[2-(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)-5-チアゾリル]エチル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2, 4-ジ(トリフルオロメチル)フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-トリフルオロメトキシフェニル-4-チアゾリルメチル基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-メチル-5-トリフルオロメトキシフェニル)-4-チアゾリル)エチル基、3-(2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル

) プロピル基、3-(5-チアゾリル) プロピル基、3-[ (2-メトキシ-4-トリフルオロメチルフェニル) -4-チアゾリル] プロピル基、4-(2-チアゾリル) プチル基、4-(4-チアゾリル) プチル基、3-(5-チアゾリル) プチル基、4-[4-(2-クロロ-4-メチルフェニル) -2-チアゾリル] プチル基、5-(2-チアゾリル) ペンチル基、5-[5-(2-フルオロ-3-メトキシフェニル) -2-チアゾリル] ペンチル基、5-(4-チアゾリル) ペンチル基、5-(5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-チアゾリル) ヘキシル基、5-(4-チアゾリル) ヘキシル基、5-(5-チアゾリル) ヘキシル基等のチアゾリルC1~6アルキル基(チアゾール環上には、1~2個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい]が置換していてもよい)を挙げることができる。

#### 【0062】

C1~6アルコキシカルボニル基とは、上記で定義されたC1~6アルコキシ基とカルボニル基で構成された基であって、例えば、メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基、n-ブトキシカルボニル基、イソブトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、sec-ブトキシカルボニル基、n-ペントキシカルボニル基、ネオペントキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカルボニル基、イソヘキシルオキシカルボニル基、3-メチルペントキシカルボニル基等を挙げることができる。

#### 【0063】

ベンゾイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、ベンゾイル基、2-フルオロベンゾイル基、3-フルオロベンゾイル基、4-フルオロベンゾイル基、2,3-ジフルオロベンゾイル基、3,4-ジフルオロベンゾイル基、2-クロロベンゾイル基、3-クロロベンゾイル基、4-クロロベンゾイル基、2,3-ジクロロベンゾイル基、3,4-ジクロロベンゾイル基、2,4,6-トリクロロベンゾイル基、4-ヨードベンゾイル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンゾイル基、2-ブロモベンゾイル基、3-ブロモベンゾイル基、4-ブロモベンゾイル基、2,3-ジブロモベンゾイル基、3,4-ジブロモベンゾイル基、2-メチルベンゾイル基、3-メチルベンゾイル基、4-メチルベンゾイル基、2,3-ジメチルベンゾイル基、3,4-ジメチルベンゾイル基、3,4,5-トリメチルベンゾイル基、2-トリフルオロメチルベンゾイル基、3-トリフルオロメチルベンゾイル基、4-トリフルオロメチルベンゾイル基、2-メトキシベンゾイル基、3-メトキシベンゾイル基、4-メトキシベンゾイル基、3,4-ジメトキシベンゾイル基、2,4,6-トリメトキシベンゾイル基、2-トリフルオロメトキシベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシベンゾイル基、4-トリフルオロメトキシベンゾイル基、2-メトキシ-3-フルオロベンゾイル基、3-メチル-4-クロロベンゾイル基、3-トリフルオロメトキシ-4-メチルベンゾイル基、2-メトキシ-4-トリフルオロメチルベンゾイル基等のベンゾイル基(フェニル環上にはハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)を挙げることができる。

#### 【0064】

フェニルカルバモイル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、フェニル環上にハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換

していてもよいアニリン、N-C1～6アルキルアニリン又はN-フェニルC1～6アルキルアニリンとカルボニル基から構成される基であつて、例えば、フェニルカルバモイル基、2-フルオロフェニルカルバモイル基、3-フルオロフェニルカルバモイル基、4-フルオロフェニルカルバモイル基、2-クロロフェニルカルバモイル基、3-クロロフェニルカルバモイル基、4-クロロフェニルカルバモイル基、2-ブromoフェニルカルバモイル基、3-ブromoフェニルカルバモイル基、4-ブromoフェニルカルバモイル基、2-ヨードフェニルカルバモイル基、3-ヨードフェニルカルバモイル基、4-ヨードフェニルカルバモイル基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモイル基、2, 6-ジクロロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルカルバモイル基、2-メチルフェニルカルバモイル基、3-メチルフェニルカルバモイル基、4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイル基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイル基、2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイル基、2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイル基、N-(2-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ブromoフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-ヨードフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 3-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 6-ジフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 3-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 5-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 6-ジクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(3-メチル-4-クロロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-クロロ-4-メチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-メチル-3-フルオロフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(2-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-(4-トリフルオロメチルフェニル)-N-メチルカルバモイル基、N-ベンジル-N-フェニルカルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-フルオロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-クロロフェニル)カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-クロロフェニル)カルバモイル基、

ニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ブロモフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ブロモフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ブロモフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-ヨードフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-ヨードフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-ヨードフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 3-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 5-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 6-ジフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 3-ジクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4-ジクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 5-ジクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4-ジクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 6-ジクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4, 5-トリフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-メチル-4-クロロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-クロロ-4-メチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-メチル-3-フルオロフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(2-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(3-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、N-ベンジル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイル基、4-ペンチルフェニルカルバモイル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイル基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイル基、3, 4-ジメトキシフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシフェニルカルバモイル基、3-メトキシフェニルカルバモイル基、4-メトキシフェニルカルバモイル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイル基、2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイル基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、3-n-ヘプタフル

オロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイル基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイル基等を挙げることができる。

【 0 0 6 5 】

フェニルC 2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC 1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換又はハロゲン原子、ハロゲンC 1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC 1～6アルコキシ基から選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されたフェニル基と炭素数2から6で二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC 2～6アルケニル基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC 2～6アルケニル基としては、例えば、2-フェニルビニル基、3-フェニル-2-プロペニル基（慣用名：シンナミル基）、4-フェニル-2-ブテニル基、4-フェニル-3-ブテニル基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニル基、5-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニル基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-プロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニル

ル基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3,4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、3-(3,5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニル基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニル基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニル基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニル基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニル基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

#### 【0066】

フェニル基〔フェニル環上には、ハロゲンが置換していてもよい〕としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-プロモフェニル基、3-プロモフェニル基、4-プロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2,3-ジフルオロフェニル基、3,4-ジフルオロフェニル基、3,5-ジフルオロフェニル基、2,4-ジフルオロフェニル基、2,6-ジフルオロフェニル基、2,3-ジクロロフェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、3,5-ジクロロフェニル基、2,4-ジクロロフェニル基、2,6-ジクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、3,4,5-トリクロロフェニル基、2,4,6-トリフルオロフェニル基、2,4,6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-プロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2,3,4-トリクロロフェニル基、3,4,5-トリフルオロフェニル基、2,4,6-トリプロモフェニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニル基等のフェニル環上にハロゲン原子が1~5個置換していてもよいフェニル基を挙げることができる。

#### 【0067】

フェニルC1~6アルコキシC1~6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基とC1~6アルキル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシメチル基、2-フェニルエトキシメチル基、3-フェニルプロポキシメチル基、2-フェニルプロポキシメチル基、4-フェニルブトキシメチル基、5-フェニルペントキシメチル基、4-フェニルペントキシメチル基、6-フェニルヘキシルオキシメチル基、2-フルオロベンジルオキシメチル基、2-(3-フルオロベンジルオキシ)エチル基、1-(4-フルオロベンジルオキシ)エチル基、3-[2-(2-フルオロフェニル)エトキシ]プロピル基、4-[2-(3-フルオロフェニル)エトキシ]ブチル基、5-[2-(4-フルオロフェニル)エトキシ]ペンチル基、6-(2-クロロベンジルオキシ)ヘキシル基、3-クロロベンジルオキシメチル基、2-(4-クロロベンジルオキシ)エチル基、1-(2-フルオロ-4-プロモベンジルオキシ)エチル基、3-(4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシ)プロピル基、4-(2,3,4-トリクロロベンジルオキシ)ブチル基、5-(3,4,5-トリフルオロベンジルオキシ)ペンチル基、6-(2,3,4,5,6-ペンタフルオロベンジルオキシ)ヘキシル基、2,4,6-トリクロロベンジルオキシメチル基、2-(4-イソプロピルベンジルオキシ)エチル基、1-(4-n-ブチルベンジルオキシ)エチル基、3-(4-メチルベンジルオキシ)プロピル基、4-(2-メチルベンジルオキシ)ブチル基、5-(3-メチルベンジルオキシ)ペンチル基、6-(2,4-ジメチルベンジルオキシ)ヘキシル基、2,3-ジメチルベンジルオキシメチル基、2-(2,6-ジメチルベンジルオキシ)エチル基、1-(3,5-ジメチルベンジルオキシ)エチル基、3-(2,5-ジメチルベンジルオキシ)プロピル基、4-(2,4,6-トリメチルベンジルオキシ)ブチル基、5-(3,5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ)

シ) ベンチル基、6-(4-イソプロポキシベンジルオキシ)ヘキシル基、4-n-ブトキシベンジルオキシメチル基、2-(4-メトキシベンジルオキシ)エチル基、1-(2-メトキシベンジルオキシ)]エチル基、3-(3-メトキシベンジルオキシ)プロピル基、4-(2, 4-ジメトキシベンジルオキシ)ブチル基、5-(2, 3-ジメトキシベンジルオキシ)ベンチル基、6-(2, 6-ジメトキシベンジルオキシ)ヘキシル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシメチル基、2-(2, 5-ジメトキシベンジルオキシ)エチル基、1-(2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ)エチル基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシ)プロピル基、4-(2-イソプロポキシベンジルオキシ)ブチル基、5-(3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ)ベンチル基、6-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)ヘキシル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシメチル基、2-(4-プロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ)エチル基、1-[2-(2-クロロフェニル)エトキシ]メチル基、3-[2-(3-クロロフェニル)エトキシ]プロピル基、4-[2-(4-クロロフェニル)エトキシ]ブチル基、5-[2-トリフルオロメチルベンジルキシ]ベンチル基、6-(3-トリフルオロメチルベンジルオキシ)ヘキシル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシメチル基、2-(2-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)エチル基、3-(4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ)プロピル基、4-[2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ブチル基、5-[2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ベンチル基、6-[2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ]ヘキシル基、[2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ]メチル基、2-[2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ]エチル基、1-[2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ]エチル基、3-[3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ]プロピル基、4-[3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ]ブチル基、5-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ]ベンチル基、6-[3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ]ヘキシル基、[3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ]メチル基、2-[3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ]エチル基、1-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシ]エチル基、3-[5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ]ブチル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシ]ベンチル基、6-[6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ]ヘキシル基、[6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ]メチル基、2-[6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシ]エチル基等を挙げることができる。

#### 【0068】

フェニルC1~6アルコキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよいフェニルC1~6アルコキシ基であって、例えば、ベンジルオキシ基、2-フェニルエトキシ基、3-フェニルプロポキシ基、2-フェニルプロポキシ基、4-フェニルブトキシ基、5-フェニルペントキシ基、4-フェニルペントキシ基、6-フェニルヘキシルオキシ基、2-フルオロベンジルオキシ基、3-フルオロベンジルオキシ基、4-フルオロベンジルオキシ基、2-(2-フルオロフェニル)エトキシ基、2-(3-フルオロフェニル)エトキシ基、2-(4-フルオロフェニル)エトキシ基、2-クロロベンジルオキシ基、3-クロロベンジルオキシ基、4-クロロベンジルオキシ基、2-フルオロ-4-プロモベンジルオキシ基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリ

クロロベンジルオキシ基、4-イソプロピルベンジルオキシ基、4-n-ブチルベンジルオキシ基、4-メチルベンジルオキシ基、2-メチルベンジルオキシ基、3-メチルベンジルオキシ基、2, 4-ジメチルベンジルオキシ基、2, 3-ジメチルベンジルオキシ基、2, 6-ジメチルベンジルオキシ基、3, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 5-ジメチルベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシ基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-イソプロポキシベンジルオキシ基、4-n-ブトキシベンジルオキシ基、4-メトキシベンジルオキシ基、2-メトキシベンジルオキシ基、3-メトキシベンジルオキシ基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシ基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシ基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-イソプロポキシベンジルオキシ基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシ基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-(2-クロロフェニル)エトキシ基、2-(3-クロロフェニル)エトキシ基、2-(4-クロロフェニル)エトキシ基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシ基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシ基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エトキシ基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ基、2-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エトキシ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロポキシ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロポキシ基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ブトキシ基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペントキシ基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペントキシ基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルオキシ基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルオキシ基等を挙げることができる。

#### 【0069】

フェニルC2～6アルケニルオキシ基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)とは、無置換又はハロゲン原子、ハロゲンC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基から選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換されたフェニル基と炭素数2から6で少なくとも二重結合を1～3個有するアルケニル基から構成される基である。フェニルC2～6アルケニルオキシ基は、トランス体及びシス体の両者を包含する。このようなフェニルC2～6アルケニルオキシ基としては、例えば、2-フェニルビニルオキシ基、3-フェニル-2-プロペニルオキシ基(慣用名:シンナミルオキシ基)、4-フェニル-2-ブテニルオキシ基、4-フェニル-3-ブテニルオキシ基、4-フェニル-1, 3-ブタジエニルオキシ基、5-フェニル-1, 3, 5-ヘキサトリエニルオキシ基、3-(2-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 4-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジフルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-クロロフェニル)-



2-プロペニルオキシ基、3-(4-クロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 4-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-メチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-フルオロ-4-ブロモフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3, 4-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-イソプロピルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-n-ブチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 6-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 5-ジメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-n-ブトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 3-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 6-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-メチル-4-フルオロフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(2-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(4-メトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 4-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、3-(3, 5-ジメトキシフェニル)-2-プロペニルオキシ基、4-(4-クロロフェニル)-2-ブテニルオキシ基、4-(4-クロロフェニル)-3-ブテニルオキシ基、5-(4-クロロフェニル)-2-ペンテニルオキシ基、5-(4-クロロフェニル)-4-ペンテニルオキシ基、5-(4-クロロフェニル)-3-ペンテニルオキシ基、6-(4-クロロフェニル)-5-ヘキセニルオキシ基、6-(4-クロロフェニル)-4-ヘキセニルオキシ基、6-(4-クロロフェニル)-3-ヘキセニルオキシ基等を挙げることができる。

#### 【0070】

置換基として水酸基を有することのあるC1~6アルキル基としては、前記C1~6アルキル基に加えて、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、2, 3-ジヒドロキシプロピル基、4-ヒドロキシブチル基、3, 4-ジヒドロキシブチル基、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル基、5-ヒドロキシペンチル基、6-ヒドロキシヘキシル基、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基、2, 3, 4-トリヒドロキシブチル基等の水酸基を1~3個有することのあるC1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

## 【0071】

C1～6アルカノイル基としては、炭素原子数1～6で構成される脂肪族カルボン酸から誘導される基であって、例えば、ホルミル基、アセチル基、プロピオニル基、ブチリル基、ペンタノイル基、ヘキサノイル基等が挙げられる。

## 【0072】

フェニルC1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、上で定義したハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニルC1～6アルコキシ基とカルボニル基で構成される基であって、例えば、ベンジルオキシカルボニル基、2-フェニルエトキシカルボニル基、3-フェニルプロポキシカルボニル基、2-フェニルプロポキシカルボニル基、4-フェニルブトキシカルボニル基、5-フェニルペントキシカルボニル基、4-フェニルペントキシカルボニル基、6-フェニルヘキシロキシカルボニル基、2-フルオロベンジルオキシカルボニル基、3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2-（2-フルオロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-フルオロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-フルオロフェニル）エトキシカルボニル基、2-クロロベンジルオキシカルボニル基、3-クロロベンジルオキシカルボニル基、4-クロロベンジルオキシカルボニル基、2-フルオロ-4-プロモベンジルオキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロピルベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブチルベンジルオキシカルボニル基、4-メチルベンジルオキシカルボニル基、2-メチルベンジルオキシカルボニル基、3-メチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメチルベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、4-n-ブトキシベンジルオキシカルボニル基、4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-メトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 5-ジメトキシベンジルオキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルオキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-イソプロポキシベンジルオキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシベンジルオキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロベンジルオキシカルボニル基、4-プロモ-3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-（2-クロロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-クロロフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-クロロフェニル）エトキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルベンジルオキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシベンジルオキシカルボニル基、2-（3-トリフルオロメチルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（4-トリフルオロメチルフェニル）エトキシカルボニル基、2-（2-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、2-（3-トリフルオロメトキシフェニル）エトキシカルボニル基、2-（

(4-トリフルオロメトキシフェニル) エトキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル) プロポキシカルボニル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル) ブトキシカルボニル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル) ペントキシカルボニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ペントキシカルボニル基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシロキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル) ヘキシロキシカルボニル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル) ヘキシロキシカルボニル基等を挙げることができる。

#### 【0073】

置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジペンチルアミノ基、ジヘキシルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基、N-エチル-N-プロピルアミノ基、N-メチル-N-ブチルアミノ基、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基、N-メチル-N-アセチルアミノ基、アセチルアミノ基、ホルミルアミノ基、プロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、イソブチリルアミノ基、ペンタノイルアミノ基、ヘキサノイルアミノ基、N-エチル-N-アセチルアミノ基等の置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を1~2個有することのあるアミノ基を挙げることができる。

#### 【0074】

1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい)としては、例えば、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-2-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-3-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-7-キノリル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2, 4-ジオキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-6-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-4-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-7-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-5-キノリル基、2-オキソ-1, 2, 3, 4-テトラヒドロ-3-キノリル基等の1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

#### 【0075】

C1~6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアルキル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基、ペンタンスルホニル基、ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

#### 【0076】

C3~8シクロアルキル基とは、構成する炭素原子数が3個ないしは8個の3員環、4員環、5員環、6員環、7員環及び8員環の環状アルキル基であって、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘキシル基、シクロヘプチル基、

シクロオクチル基、3, 4-ジメチルシクロペンチル基、3, 3-ジメチルシクロヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0077】

C1~6アルキルチオ基とは、炭素原子が1ないし6から構成される直鎖状又は分岐鎖状のアルキルチオ基であって、例えば、メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、n-ブチルチオ基、イソブチルチオ基、tert-ブチルチオ基、sec-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、ネオペンチルチオ基、n-ヘキシルチオ基、イソヘキシルチオ基、3-メチルペンチルチオ基等を挙げることができる。

#### 【0078】

フェニルスルホニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、無置換のフェニルスルホニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェニルスルホニル基であって、例えば、フェニルスルホニル基、2-フルオロフェニルスルホニル基、3-フルオロフェニルスルホニル基、4-フルオロフェニルスルホニル基、2-クロロフェニルスルホニル基、3-クロロフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、2-ブロモフェニルスルホニル基、3-ブロモフェニルスルホニル基、4-ブロモフェニルスルホニル基、2-ヨードフェニルスルホニル基、3-ヨードフェニルスルホニル基、4-ヨードフェニルスルホニル基、2, 3-ジフルオロフェニルスルホニル基、3, 4-ジフルオロフェニルスルホニル基、3, 5-ジフルオロフェニルスルホニル基、2, 4-ジフルオロフェニルスルホニル基、2, 6-ジフルオロフェニルスルホニル基、2, 3-ジクロロフェニルスルホニル基、3, 4-ジクロロフェニルスルホニル基、3, 5-ジクロロフェニルスルホニル基、2, 4-ジクロロフェニルスルホニル基、2, 6-ジクロロフェニルスルホニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルスルホニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニルスルホニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニルスルホニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニルスルホニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルスルホニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブチルフェニルスルホニル基、2, 4-ジメチルフェニルスルホニル基、2, 3-ジメチルフェニルスルホニル基、2, 6-ジメチルフェニルスルホニル基、3, 5-ジメチルフェニルスルホニル基、2, 5-ジメチルフェニルスルホニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブトキシフェニルスルホニル基、2, 4-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 3-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 6-ジメトキシフェニルスルホニル基、3, 5-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 5-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニルスルホニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-メチル-4-フルオロフェニルスルホニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-メチルフェニルスルホニル基、3-メチルフェニルスルホニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-クロロフェニルスルホニル基、3-メチル-4-クロロフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-フルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、2-イソプロピルフェニルスルホニル基、3-イソプロピルフェニルスルホニル基、4-イソプロピルフェニルスルホニル基、2-tert-ブチルフェニルスルホニル基、3-tert-ブ

チルフェニルスルホニル基、4-tert-ブチルフェニルスルホニル基、2-sec-ブチルフェニルスルホニル基、3-sec-ブチルフェニルスルホニル基、4-sec-ブチルフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-ペンチルフェニルスルホニル基、4-ヘキシルフェニルスルホニル基、2-メトキシフェニルスルホニル基、3-メトキシフェニルスルホニル基、4-メトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルスルホニル基、2, 6-ジメトキシフェニルスルホニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルスルホニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、2-イソプロポキシフェニルスルホニル基、3-イソプロポキシフェニルスルホニル基、4-イソプロポキシフェニルスルホニル基、2-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、3-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、4-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、2-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、3-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、4-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルスルホニル基等を挙げることができる。

#### 【0079】

水酸基置換C1~6アルキル基としては、例えば、ヒドロキシメチル基、2-ヒドロキシエチル基、1-ヒドロキシエチル基、3-ヒドロキシプロピル基、2, 3-ジヒドロキシプロピル基、4-ヒドロキシブチル基、3, 4-ジヒドロキシブチル基、1, 1-ジメチル-2-ヒドロキシエチル基、5-ヒドロキシペンチル基、6-ヒドロキシヘキシル基、2-メチル-3-ヒドロキシプロピル基、2, 3, 4-トリヒドロキシブチル基等の水酸基を1~3個有するC1~6の直鎖又は分枝鎖状アルキル基を挙げることができる。

#### 【0080】

フェニルC1~6アルキル基（フェニル環上には、置換基としてC1~4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換のフェニルC1~6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にC1~4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された基が1~5個、好ましくは1~3個置換している基（置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~3個置換しているのがよい）であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2, 3-メチレンジオキシベンジル基、3, 4-メチレンジオキシベンジル基、3-フェニルベンジル基、2-フェニルベンジル基、4-フェニルベンジル基、3, 4-ジフェニルベンジル基、2, 4,

6-トリフェニルベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブロモベンジル基、3-ブロモベンジル基、4-ブロモベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブロモベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-プロモ-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、1-(3-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチル基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチル基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピル基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピル基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピル基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチル基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチル基、4-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシル基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0081】

フェニルスルホニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基及びC1～4アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）とは、無置換のフェニルスルホニル基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基及びC1～4アルキレンジオキシ基からなる群より選択された置換基を1～5個、好ま

しくは1~3個有するフェニルスルホニル基(置換基がC1~4アルキレンジオキシ基の場合は、1~3個置換しているのがよい)であって、例えば、フェニルスルホニル基、2-フルオロフェニルスルホニル基、3-フルオロフェニルスルホニル基、4-フルオロフェニルスルホニル基、2-クロロフェニルスルホニル基、3-クロロフェニルスルホニル基、4-クロロフェニルスルホニル基、2-ブロモフェニルスルホニル基、3-ブロモフェニルスルホニル基、4-ブロモフェニルスルホニル基、2-ヨードフェニルスルホニル基、3-ヨードフェニルスルホニル基、4-ヨードフェニルスルホニル基、2,3-ジフルオロフェニルスルホニル基、3,4-ジフルオロフェニルスルホニル基、3,5-ジフルオロフェニルスルホニル基、2,4-ジフルオロフェニルスルホニル基、2,6-ジフルオロフェニルスルホニル基、2,3-ジクロロフェニルスルホニル基、3,4-ジクロロフェニルスルホニル基、3,5-ジクロロフェニルスルホニル基、2,4-ジクロロフェニルスルホニル基、2,6-ジクロロフェニルスルホニル基、3,4,5-トリフルオロフェニルスルホニル基、3,4,5-トリクロロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリフルオロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリクロロフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニルスルホニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニルスルホニル基、2,3,4-トリクロロフェニルスルホニル基、3,4,5-トリフルオロフェニルスルホニル基、2,3,4,5,6-ペンタフルオロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブチルフェニルスルホニル基、2,4-ジメチルフェニルスルホニル基、2,3-ジメチルフェニルスルホニル基、2,6-ジメチルフェニルスルホニル基、3,5-ジメチルフェニルスルホニル基、2,5-ジメチルフェニルスルホニル基、3,5-ジトリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-n-ブトキシフェニルスルホニル基、2,4-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,3-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,6-ジメトキシフェニルスルホニル基、3,5-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,5-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,4,6-トリメトキシフェニルスルホニル基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-メチル-4-フルオロフェニルスルホニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-メチルフェニルスルホニル基、3-メチルフェニルスルホニル基、4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-クロロフェニルスルホニル基、3-メチル-4-クロロフェニルスルホニル基、2-クロロ-4-メチルフェニルスルホニル基、2-メチル-3-フルオロフェニルスルホニル基、2-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメチルフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルスルホニル基、2-イソプロピルフェニルスルホニル基、3-イソプロピルフェニルスルホニル基、4-イソプロピルフェニルスルホニル基、2-tert-ブチルフェニルスルホニル基、3-tert-ブチルフェニルスルホニル基、4-tert-ブチルフェニルスルホニル基、2-sec-ブチルフェニルスルホニル基、3-sec-ブチルフェニルスルホニル基、4-sec-ブチルフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルスルホニル基、4-ペンチルフェニルスルホニル基、4-ヘキシルフェニルスルホニル基、2-メトキシフェニルスルホニル基、3-メトキシフェニルスルホニル基、4-メトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルスルホニル基、2,6-ジメトキシフェニルスルホニル基、2,3,4-トリフルオロフェニルスルホニル基、2,4,6-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-フルオロ-4-トリ

リフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニルスルホニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニルスルホニル基、2-イソプロポキシフェニルスルホニル基、3-イソプロポキシフェニルスルホニル基、4-イソプロポキシフェニルスルホニル基、2-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、3-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、4-tert-ブトキシフェニルスルホニル基、2-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、3-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、4-sec-ブトキシフェニルスルホニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルスルホニル基、4-n-ペントキシフェニルスルホニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルスルホニル基、2, 3-メチレンジオキシフェニルスルホニル基、3, 4-メチレンジオキシフェニルスルホニル基等を挙げることができる。

#### 【0082】

フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換してもよい）としては、例えば、フェノキシカルボニル基、2-フルオロフェノキシカルボニル基、3-フルオロフェノキシカルボニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシカルボニル基、4-フルオロフェノキシカルボニル基、2-クロロフェノキシカルボニル基、3-クロロフェノキシカルボニル基、4-クロロフェノキシカルボニル基、2, 3-ジクロロフェノキシカルボニル基、3, 4-ジクロロフェノキシカルボニル基、3, 5-ジクロロフェノキシカルボニル基、2-ブロモフェノキシカルボニル基、3-ブロモフェノキシカルボニル基、4-ブロモフェノキシカルボニル基、2-メチルフェノキシカルボニル基、3-メチルフェノキシカルボニル基、4-メチルフェノキシカルボニル基、2-エチルフェノキシカルボニル基、3-エチルフェノキシカルボニル基、4-エチルフェノキシカルボニル基、4-プロピルフェノキシカルボニル基、4-tert-ブチルフェノキシカルボニル基、4-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 4, 5-トリメチルフェノキシカルボニル基、4-ペンチルフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルフェノキシカルボニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシカルボニル基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシカルボニル基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシカルボニル基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシカルボニル基、4-イソプロピルフェノキシカルボニル基、4-n-ブチルフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 6-ジメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 5-ジメチルフェノキシカルボニル基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2, 4-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、2, 6-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-メチル-4-フルオロフェノキシカルボニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメチルフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシカルボニル基、2-メトキシフェノキシカルボニル基、3-メトキシ



フェノキシカルボニル基、4-メトキシフェノキシカルボニル基、2-エトキシフェノキシカルボニル基、3-エトキシフェノキシカルボニル基、4-エトキシフェノキシカルボニル基、4-プロポキシフェノキシカルボニル基、4-tert-ブトキシフェノキシカルボニル基、4-n-ブトキシフェノキシカルボニル基、2,3-ジメトキシフェノキシカルボニル基、3,4,5-トリメトキシフェノキシカルボニル基、4-ペントキシフェノキシカルボニル基、4-ヘキシルオキシフェノキシカルボニル基、2-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、3-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、4-トリフルオロメトキシフェノキシカルボニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシカルボニル基等のフェノキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換してもよい）を挙げることができる。

**【0083】**

C1~6アルコキシ置換C1~6アルキル基とは、上記C1~6アルキル基とC1~6アルコキシ基で構成される基であって、例えば、メトキシメチル基、2-メトキシエチル基、3-メトキシプロピル基、4-メトキシブチル基、5-メトキシペンチル基、6-メトキシヘキシル基、エトキシメチル基、2-エトキシエチル基、3-エトキシプロピル基、2-イソプロポキシエチル基、tert-ブトキシメチル基、ペンチルオキシメチル基、ヘキシルオキシメチル基、2-(tert-ブトキシ)エチル基、3-(tert-ブトキシ)プロピル基、6-(tert-ブトキシ)ヘキシル基、4-(tert-ブトキシ)ブチル基等を挙げることができる。

**【0084】**

C2~6アルケニル基としては、例えば、ビニル基、2-プロペニル基、3-ブテニル基、2-ブテニル基、4-ペンテニル基、3-ペンテニル基、5-ヘキセニル基、4-ヘキセニル基、3-ヘキセニル基等を挙げることができる。

**【0085】**

C1~6アルコキシ置換C2~6アルカノイル基とは、上記C1~6アルキル基とC2~6アルカノイル基で構成される基であって、例えば、2-メトキシアセチル基、2-メトキシプロピオニル基、3-メトキシプロピオニル基、4-メトキシブチリル基、5-メトキシペンタノイル基、6-メトキシヘキサノイル基、2-エトキシアセチル基、2-エトキシプロピオニル基、3-エトキシプロピオニル基、2-イソプロポキシプロピオニル基、2-(tert-ブトキシ)アセチル基、2-ペンチルオキシアセチル基、2-ヘキシルオキシアセチル基、2-(tert-ブトキシ)プロピオニル基、3-(tert-ブトキシ)プロピオニル基、6-(tert-ブトキシ)ヘキサノイル基、4-(tert-ブトキシ)ブチリル基等を挙げることができる。

**【0086】**

C3~8シクロアルキル置換C1~6アルキル基とは、炭素数3乃至8個の環状アルキル基と炭素数1乃至6個のアルキル基で構成される基であって、例えば、シクロプロピルメチル基、2-シクロプロピルエチル基、3-シクロプロピルプロピル基、4-シクロプロピルブチル基、5-シクロプロピルペンチル基、6-シクロプロピルヘキシル基、シクロブチルメチル基、2-シクロブチルエチル基、3-シクロブチルプロピル基、4-シクロブチルブチル基、5-シクロブチルペンチル基、6-シクロブチルヘキシル基、シクロペンチルメチル基、2-シクロペンチルエチル基、3-シクロペンチルプロピル基、4-シクロペンチルブチル基、5-シクロペンチルペンチル基、6-シクロペンチルヘキシル基、シクロヘキシルメチル基、2-シクロヘキシルエチル基、3-シクロヘキシルプロピル基、4-シクロヘキシルブチル基、5-シクロヘキシルペンチル基、6-シクロヘキシルヘキシル基、シクロヘプチルメチル基、2-シクロヘプチルエチル基、3-シクロヘプチルプロピル基、4-シクロヘプチルブチル基、5-シクロヘプチルペンチル基、6-シクロヘプチルヘキシル基、シクロオクチルメチル基、2-シクロオクチルエチル基、3-

シクロオクチルプロピル基、4-シクロオクチルブチル基、5-シクロオクチルペンチル基、6-シクロオクチルヘキシル基等を挙げることができる。

**【0087】**

ピリジルC1~6アルキル基としては、例えば、2-ピリジルメチル基、2-(3-ピリジル)エチル基、1-(4-ピリジル)エチル基、3-(2-ピリジル)プロピル基、4-(3-ピリジル)ブチル基、5-(4-ピリジル)ペンチル基、6-(2-ピリジル)ヘキシル基、2-メチル-3-(3-ピリジル)プロピル基、1,1-ジメチル-2-(2-ピリジル)エチル等を挙げることができる。

**【0088】**

イミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が置換していてもよい)としては、例えば、4-イミダゾリルメチル基、2-(4-イミダゾリル)エチル基、3-(2-イミダゾリル)プロピル基、4-(1-イミダゾリル)ブチル基、5-(5-イミダゾリル)ペンチル基、6-(4-イミダゾリル)ヘキシル基、2,5-ジフェニル-1-イミダゾリルメチル基、2-フェニル-4-イミダゾリルメチル基、2-(2-フェニル-4-イミダゾリル)エチル基、3-(2-フェニル-4-イミダゾリル)プロピル基、4-(2-フェニル-5-イミダゾリル)ブチル基、5-(2-フェニル-4-イミダゾリル)ペンチル基、6-(2-フェニル-4-イミダゾリル)ヘキシル基等のイミダゾリルC1~6アルキル基(イミダゾール環上には、フェニル基が1~2個置換していてもよい)を挙げることができる。

**【0089】**

1,2,3,4-テトラヒドロキノリル基(1,2,3,4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)としては、例えば、1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-2-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-5-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル基、1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2,4-ジオキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル基、2-メチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、4-エチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、2,4-ジメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1,5,6-トリメチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1,4,5,6-テトラメチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-1-キノリル基、1-プロピル-1,2,3,4-テトラヒドロ-6-キノリル基、5-n-ペンチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-4-キノリル基、6-n-ヘキシル-1,2,3,4-テトラヒドロ-7-キノリル基、7-tert-ブチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、8-n-ペンチル-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、1-n-ヘキシル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-8-キノリル基、1-メチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-5-キノリル基、3-エチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ-3-キノリル基等の1,2,3,4-テトラヒドロキノリル基(1,2,3,4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい。)を挙げることができる。

**【0090】**

置換基としてC1~6アルキル基を有することのあるアミノ基としては、例えば、アミ

ノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ブチルアミノ基、tert-ブチルアミノ基、ペンチルアミノ基、ヘキシルアミノ基、ジメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、ジプロピルアミノ基、ジブチルアミノ基、ジペンチルアミノ基、ジヘキシルアミノ基、N-メチル-N-エチルアミノ基、N-エチル-N-プロピルアミノ基、N-メチル-N-ブチルアミノ基、N-メチル-N-ヘキシルアミノ基等の置換基としてC1~6アルキル基を1~2個有することのあるアミノ基を挙げることができる。

#### 【0091】

シアノ置換C1~6アルキル基としては、例えば、シアノメチル基、2-シアノエチル基、1-シアノエチル基、3-シアノプロピル基、4-シアノブチル基、5-シアノペンチル基、6-シアノヘキシル基、2-メチル-3-シアノプロピル基、1, 1-ジメチル-2-シアノエチル基等を挙げることができる。

#### 【0092】

フリル置換C1~6アルキル基としては、例えば、2-フリルメチル基、3-フリルメチル基、2-(2-フリル)エチル基、1-(3-フリル)エチル基、3-(2-フリル)プロピル基、3-(3-フリル)プロピル基、4-(2-フリル)ブチル基、4-(3-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、5-(3-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)ヘキシル基、6-(3-フリル)ヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0093】

ピペラジニル置換C1~6アルキル基(ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]が置換していてもよい)としては、例えば、1-ピペラジニルメチル基、2-(2-ピペラジニル)エチル基、1-(1-ピペラジニル)エチル基、3-(1-ピペラジニル)プロピル基、4-(1-ピペラジニル)ブチル基、5-(2-ピペラジニル)ペンチル基、6-(1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-(4-フェニル-1-ピペラジニル)エチル基、3-(4-フェニル-1-ピペラジニル)プロピル基、4-(4-フェニル-1-ピペラジニル)ブチル基、5-(4-フェニル-1-ピペラジニル)ペンチル基、6-(4-フェニル-1-ピペラジニル)ヘキシル基、2-[4-(2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]エチル基、3-[4-(2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(2, 3-ジフルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(2-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、3-[4-(3-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(3-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(3-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、3-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(4-フルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、2-[4-(2, 3-ジクロロフェニル)-1-ピペラジニル]エチル基、3-[4-(2-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(2-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(2-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、2-[4-(3-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]エチル基、3-[4-(3-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(3-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、2-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]エチル基、3-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル

基、4-[4-(4-クロロ-3-メトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(4-クロロフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、2-[4-(2-メチルフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、2-[4-(2,4-ジメチルフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、2-[4-(2,4,6-トリメチルフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、2-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]エチル基、3-[4-(3,5-ジトリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(2-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(3-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、3-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、2-[4-(3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]エチル基、2-[4-(2-メトキシフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、2-[4-(2,4-ジメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、2-[4-(2,4,6-トリメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]メチル基、3-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、3-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、3-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]プロピル基、4-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ブチル基、5-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ペンチル基、6-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-1-ピペラジニル]ヘキシル基、2,4-ジフェニル-1-ピペラジニルメチル基、(2,4,5-トリフェニル-1-ピペラジニル)メチル基等のピペラジニル置換C1~6アルキル基(ピペラジン環上には、置換基として1~3個のフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい。]が置換していてもよい。)が挙げられる。

#### 【0094】

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>が、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する5~7員の飽和複素環基としては、例えば、ピロリジニル基、ピペラジニル基、ピペリジニル基、モルホリノ基、チオモルホリノ基、ホモピペラジニル基等を挙げることができる。

#### 【0095】

R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>が、隣接する窒素原子と共に、窒素原子、酸素原子もしくは硫黄原子を介し又は介することなく互いに結合して形成する1,2,3,4-テトラヒドロイソキノリル基、イソインドリル基又は前記例示の5~7員環の飽和の複素環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基、フェニル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ベンゾイル基[フェニル

ル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ピリジルC1～6アルキル基、C3～8シクロアルキル基、フェニルC1～6アルキル基[フェニル環上には、C1～4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、ピペリジルC1～6アルキル基、ピペリジル基、フェニルC1～6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、置換基としてフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]、C1～6アルキル基及びフェニルC1～6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよく、このような置換基としては、前記及び後記で例示したハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基、フェニル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、ベンゾイル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、ピリジルC1～6アルキル基、C3～8シクロアルキル基、フェニルC1～6アルキル基[フェニル環上には、C1～4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、置換基がC1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～3個置換するのがよい]、ピペリジルC1～6アルキル基、ピペリジル基、フェニルC1～6アルコキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、置換基としてフェニル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]、C1～6アルキル基及びフェニルC1～6アルキル基[フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよいアミノ基、ベンゾオキサゾリル基及びベンゾイミダゾリル基からなる群より選ばれた基が1～3個置換していてもよい。)を例示できる。

**【0096】**

フェニル基[フェニル環上には、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]とは、無置換のフェニル

基並びに上記定義されたフェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換の C 1 ~ 6 アルコキシからなる群より選択された置換基を 1 ~ 5 個、好ましくは 1 ~ 3 個有するフェニル基であって、例えば、フェニル基、2-フェニルフェニル基、3-フェニルフェニル基、4-フェニルフェニル基、2, 3-ジフェニルフェニル、2, 4, 6-トリフェニルフェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、4-n-ブトキシフェニル基、2, 4-ジメトキシフェニル基、2, 3-ジメトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、3, 5-ジメトキシフェニル基、2, 5-ジメトキシフェニル基、2, 4, 6-トリメトキシフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-メトキシフェニル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2-メトキシフェニル基、3-メトキシフェニル基、4-メトキシフェニル基、3-クロロ-2-メトキシフェニル基、2-フルオロ-3-メトキシフェニル基、2-フルオロ-4-メトキシフェニル基、2, 6-ジメトキシフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2-トリフルオロメトキシフェニル基、3-トリフルオロメトキシフェニル基、4-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-トリフルオロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェニル基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェニル基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェニル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェニル基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェニル基、2-イソプロポキシフェニル基、3-イソプロポキシフェニル基、4-イソプロポキシフェニル基、2-tert-ブトキシフェニル基、3-tert-ブトキシフェニル基、4-tert-ブトキシフェニル基、2-sec-ブトキシフェニル基、3-sec-ブトキシフェニル基

、4-sec-ブトキシフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニル基、4-n-ペントキシフェニル基、4-n-ヘキシルオキシフェニル基等を挙げることができる。

【0097】

フェニルC1～6アルキル基〔フェニル環上には、C1～4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、無置換のフェニルC1～6アルキル基並びにそれらの基を構成するフェニル環上にC1～4アルキレンジオキシ基、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選択された基が1～5個、好ましくは1～3個置換している基（置換基がC1～4アルキレンジオキシ基の場合は、1～3個置換しているのがよい）であって、例えば、ベンジレンジオキシ基の場合は、1～3個置換しているのがよい）であって、例えば、ベンジル基、1-フェネチル基、2-フェネチル基、3-フェニルプロピル基、2-フェニルプロピル基、4-フェニルブチル基、5-フェニルペンチル基、4-フェニルペンチル基、6-フェニルヘキシル基、2, 3-メチレンジオキシベンジル基、3, 4-メチレンジオキシベンジル基、2-フルオロベンジル基、3-フルオロベンジル基、4-フルオロベンジル基、2-クロロベンジル基、3-クロロベンジル基、4-クロロベンジル基、2-ブromoベンジル基、3-ブromoベンジル基、4-ブromoベンジル基、2-ヨードベンジル基、3-ヨードベンジル基、4-ヨードベンジル基、2, 3-ジフルオロベンジル基、3, 4-ジフルオロベンジル基、3, 5-ジフルオロベンジル基、2, 4-ジフルオロベンジル基、2, 6-ジフルオロベンジル基、2, 3-ジクロロベンジル基、3, 4-ジクロロベンジル基、3, 5-ジクロロベンジル基、2, 4-ジクロロベンジル基、2, 6-ジクロロベンジル基、2-フルオロ-4-ブromoベンジル基、4-クロロ-3-フルオロベンジル基、2, 3, 4-トリクロロベンジル基、3, 4, 5-トリフルオロベンジル基、2, 4, 6-トリクロロベンジル基、4-イソプロピルベンジル基、4-n-ブチルベンジル基、4-メチルベンジル基、2-メチルベンジル基、3-メチルベンジル基、2, 4-ジメチルベンジル基、2, 3-ジメチルベンジル基、2, 6-ジメチルベンジル基、3, 5-ジメチルベンジル基、2, 5-ジメチルベンジル基、2, 4, 6-トリメチルベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジル基、4-イソプロポキシベンジル基、4-n-ブトキシベンジル基、4-メトキシベンジル基、2-メトキシベンジル基、3-メトキシベンジル基、2, 4-ジメトキシベンジル基、2, 3-ジメトキシベンジル基、2, 6-ジメトキシベンジル基、3, 5-ジメトキシベンジル基、2, 5-ジメトキシベンジル基、2, 4, 6-トリメトキシベンジル基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジル基、2-イソプロポキシベンジル基、3-クロロ-4-メトキシベンジル基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジル基、3-メチル-4-フルオロベンジル基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジル基、2-トリフルオロメチルベンジル基、3-トリフルオロメチルベンジル基、4-トリフルオロメチルベンジル基、2-ペンタフルオロエチルベンジル基、3-ペンタフルオロエチルベンジル基、4-ペンタフルオロエチルベンジル基、2-トリフルオロメトキシベンジル基、3-トリフルオロメトキシベンジル基、4-トリフルオロメトキシベンジル基、2-ペンタフルオロエトキシベンジル基、3-ペンタフルオロエトキシベンジル基、4-ペンタフルオロエトキシベンジル基、2-（2-トリフルオロメチルフェニル）エチル基、2-（3-トリフルオロメチルフェニル）エチル基、2-（4-トリフルオロメチルフェニル）エチル基、2-（2-トリフルオロメトキシフェニル）エチル基、3-トリフルオロメトキシフェニル）エチル基、2-（4-トリフルオロメトキシフェニル）エチル基、2-（2-ペンタフルオロエトキシフェニル）エチル基、2-（4-ペンタフルオロエトキシフェニル）エチル基、3-（2-トリフルオロメチルフェニル）プロピル基、3-（3-トリフルオロメチルフェニル）プロピル基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）プロピル基、3-（2-

ートリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3- (3-ートリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3- (4-ートリフルオロメトキシフェニル) プロピル基、3- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、3- (4-ペンタフルオロエトキシフェニル) プロピル基、4- (3-ペンタフルオロエトキシフェニル) ブチル基、5- (4-ートリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4- (4-ートリフルオロメチルフェニル) ペンチル基、4- (4-ートリフルオロメトキシフェニル) ペンチル基、6- (3-ートリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6- (4-ートリフルオロメチルフェニル) ヘキシル基、6- (4-ートリフルオロメトキシフェニル) ヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0098】

ピペリジルC1~6アルキル基としては、例えば、ピペリジン-1-イルメチル基、ピペリジン-2-イルエチル基、ピペリジン-3-イルプロピル基、ピペリジン-4-イルブチル基、ピペリジン-1-イルペンチル基、ピペリジン-2-イルヘキシル基等を挙げることができる。

#### 【0099】

フェノキシ基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕とは、無置換のフェノキシ基並びに上記定義されたハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選択された置換基を1~5個、好ましくは1~3個有するフェノキシ基であって、例えば、フェノキシ基、2-フルオロフェノキシ基、3-フルオロフェノキシ基、4-フルオロフェノキシ基、2-クロロフェノキシ基、3-クロロフェノキシ基、4-クロロフェノキシ基、2-ブロモフェノキシ基、3-ブロモフェノキシ基、4-ブロモフェノキシ基、2-ヨードフェノキシ基、3-ヨードフェノキシ基、4-ヨードフェノキシ基、2, 3-ジフルオロフェノキシ基、3, 4-ジフルオロフェノキシ基、3, 5-ジフルオロフェノキシ基、2, 4-ジフルオロフェノキシ基、2, 6-ジフルオロフェノキシ基、2, 3-ジクロロフェノキシ基、3, 4-ジクロロフェノキシ基、3, 5-ジクロロフェノキシ基、2, 4-ジクロロフェノキシ基、2, 6-ジクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェノキシ基、2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェノキシ基、2-フルオロ-4-ブロモフェノキシ基、4-クロロ-3-フルオロフェノキシ基、2, 3, 4-トリクロロフェノキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェノキシ基、4-n-ブチルフェノキシ基、2, 4-ジメチルフェノキシ基、2, 3-ジメチルフェノキシ基、2, 6-ジメチルフェノキシ基、3, 5-ジメチルフェノキシ基、2, 5-ジメチルフェノキシ基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシフェノキシ基、3-クロロ-4-メトキシフェノキシ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-メチル-4-フルオロフェノキシ基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-メチルフェノキシ基、3-メチルフェノキシ基、4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-クロロフェノキシ基、3-メチル-4-クロロフェノキシ基、2-クロロ-4-メチルフェノキシ基、2-メチル-3-フルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメチルフェノキシ基、3-トリフルオロメチルフェノキシ基、4-トリフルオロメチルフェノキシ基、2-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、3-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、4-ペンタフルオロエチルフェノキシ基、2-イソプロピルフェノキシ基、3-イソプロピルフェノキシ基、4-イソプロピルフェノキシ基、2-tert-ブチルフェノキシ基、3-tert-ブチルフェノキシ基、4-tert-ブチルフェノキシ基、2-sec-ブチルフェノキシ基、3-sec-ブチルフェノキシ基、4-sec-ブチルフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロブ



ロピルフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェノキシ基、4-ペンチルフェノキシ基、4-ヘキシルフェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、3-クロロ-2-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェノキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェノキシ基、2, 4, 6-トリフルオロフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-フルオロ-2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-フルオロ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-フルオロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-クロロ-2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-クロロ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-クロロ-4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-クロロ-2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-クロロ-3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-クロロ-4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ペントキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基等を挙げる  
ことができる。

#### 【0100】

置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよいアミノ基としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基、n-ヘキシルアミノ基、フェニルアミノ基、(4-クロロフェニル)アミノ基、(4-ブromoフェニル)アミノ基、(2, 4-ジクロロフェニル)アミノ基、(2, 4, 6-トリクロロフェニル)アミノ基、(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)アミノ基、(4-フルオロフェニル)アミノ基、(4-ヨードフェニル)アミノ基、(4-クロロフェニル)アミノ基、(3-メチルフェニル)アミノ基、(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、(3, 4-ジメチルフェニル)アミノ基、(3, 4, 5-トリメチルフェニル)アミノ基、(2-メトキシフェニル)アミノ基、(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ基、(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ基、(3, 5-ジメトキシフェニル)アミノ基、(2, 5-ジメトキシフェニル)アミノ基、(2, 4, 6-トリメトキシフェニル)アミノ基、N-メチル-N-(4-トリフルオロメチルフェニル)アミノ基、N-エチル-N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)アミノ基、1-フェネチルアミノ基、2-フェネチルアミノ基、3-フェニルプロピルアミノ基、2-フェニルプロピルアミノ基、4-フェニルブチルアミノ基、5-フェニルペンチルアミノ基、4-フェニルペンチルアミノ基、6-フェニルヘキシルアミノ基、2-フルオロベンジルアミノ基、3-フルオロベンジルアミノ基、N-フェニル-N-(4-フルオロベンジル)アミノ基、2-クロロベンジルアミノ基、3-クロロベンジルアミノ基、4-クロロベンジルアミノ基、2-ブromoベンジルアミノ基、N-メチル-N-(3-ブromoベンジル)アミノ基、4-ブromoベンジルアミノ基、

2-ヨードベンジルアミノ基、3-ヨードベンジルアミノ基、4-ヨードベンジルアミノ基、2, 3-ジフルオロベンジルアミノ基、3, 4-ジフルオロベンジルアミノ基、3, 5-ジフルオロベンジルアミノ基、2, 4-ジフルオロベンジルアミノ基、2, 6-ジフルオロベンジルアミノ基、2, 3-ジクロロベンジルアミノ基、3, 4-ジクロロベンジルアミノ基、3, 5-ジクロロベンジルアミノ基、2, 4-ジクロロベンジルアミノ基、2, 6-ジクロロベンジルアミノ基、2-フルオロ-4-ブromoベンジルアミノ基、4-クロロ-3-フルオロベンジルアミノ基、2, 3, 4-トリクロロベンジルアミノ基、3, 4, 5-トリフルオロベンジルアミノ基、2, 4, 6-トリクロロベンジルアミノ基、4-イソプロピルベンジルアミノ基、4-n-ブチルベンジルアミノ基、4-メチルベンジルアミノ基、2-メチルベンジルアミノ基、3-メチルベンジルアミノ基、2, 4-ジメチルベンジルアミノ基、2, 3-ジメチルベンジルアミノ基、2, 6-ジメチルベンジルアミノ基、3, 5-ジメチルベンジルアミノ基、2, 5-ジメチルベンジルアミノ基、2, 4, 6-トリメチルベンジルアミノ基、3, 5-ジトリフルオロメチルベンジルアミノ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロベンジルアミノ基、4-イソプロポキシベンジルアミノ基、4-n-ブトキシベンジルアミノ基、4-メトキシベンジルアミノ基、2-メトキシベンジルアミノ基、3-メトキシベンジルアミノ基、2, 4-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 3-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 6-ジメトキシベンジルアミノ基、3, 5-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 5-ジメトキシベンジルアミノ基、2, 4, 6-トリメトキシベンジルアミノ基、3, 5-ジトリフルオロメトキシベンジルアミノ基、2-イソプロポキシベンジルアミノ基、3-クロロ-4-メトキシベンジルアミノ基、2-クロロ-4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、3-メチル-4-フルオロベンジルアミノ基、4-ブromo-3-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、2-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、3-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、4-トリフルオロメチルベンジルアミノ基、2-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ基、3-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ基、4-ペンタフルオロエチルベンジルアミノ基、2-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、3-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、4-トリフルオロメトキシベンジルアミノ基、2-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ基、3-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ基、4-ペンタフルオロエトキシベンジルアミノ基、2-(2-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミノ基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミノ基、2-(4-トリフルオロメチルフェニル)エチルアミノ基、2-(2-トリフルオロメトキシフェニル)エチルアミノ基、3-トリフルオロメトキシフェニル)エチルアミノ基、2-(4-トリフルオロメトキシフェニル)エチルアミノ基、2-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチルアミノ基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチルアミノ基、2-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)エチルアミノ基、3-(2-トリフルオロメチルフェニル)プロピルアミノ基、3-(3-トリフルオロメチルフェニル)プロピルアミノ基、3-(4-トリフルオロメチルフェニル)プロピルアミノ基、3-(2-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルアミノ基、3-(3-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルアミノ基、3-(4-トリフルオロメトキシフェニル)プロピルアミノ基、3-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピルアミノ基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェニル)プロピルアミノ基、4-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)ブチルアミノ基、5-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルアミノ基、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)ペンチルアミノ基、4-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ペンチルアミノ基、6-(3-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルアミノ基、6-(4-トリフルオロメチルフェニル)ヘキシルアミノ基、6-(4-トリフルオロメトキシフェニル)ヘキシルアミノ基、N-メチル-N-フェニルアミノ基、N-メチル-N-ベンジルアミノ基、N-フェニル-N-ベンジルアミノ基等の置換基としてフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕、C1~6アルキル基及びフェニルC1~6アルキル基〔フェニル環上

には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい]からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよいアミノ基を挙げることができる。

# 【0101】

カルバモイルオキシ基 (アミノ基上には、C1～6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、例えば、カルバモイルオキシ基、フェニルカルバモイルオキシ基、2-フルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3-フルオロフェニルカルバモイルオキシ基、4-フルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、3-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、4-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-プロモフェニルカルバモイルオキシ基、3-プロモフェニルカルバモイルオキシ基、4-プロモフェニルカルバモイルオキシ基、2-ヨードフェニルカルバモイルオキシ基、3-ヨードフェニルカルバモイルオキシ基、4-ヨードフェニルカルバモイルオキシ基、2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 5-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 6-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 3-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 5-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 6-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4, 6-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、3-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-メチル-4-メチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ基、メチルカルバモイルオキシ基、エチルカルバモイルオキシ基、*n*-プロピルカルバモイルオキシ基、*n*-ブチルカルバモイルオキシ基、*n*-ヘキシルカルバモイルオキシ基、*n*-ペンチルカルバモイルオキシ基、*N*-メチル-*N*-フェニルカルバモイルオキシ基、*N*、*N*-ジメチルカルバモイルオキシ基、*N*-メチル-*N*-エチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2-フルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3-フルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(4-フルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2-クロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3-クロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(4-クロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2-プロモフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2-ヨードフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3-ヨードフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(4-ヨードフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2, 3-ジフルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3, 4-ジフルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3, 5-ジフルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2, 4-ジフルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2, 6-ジフルオロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2, 3-ジクロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3, 4-ジクロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(3, 5-ジクロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2, 4-ジクロロフェニル)-*N*-メチルカルバモイルオキシ基、*N*-(2, 6-ジク

ロクロフェニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3, 4, 5-トリフルオロ  
フェニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3, 4, 5-トリクロロフェニル)  
- N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2, 4, 6-トリフルオロフェニル) - N-  
メチルカルバモイルオキシ基、N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル) - N-メチルカ  
ルバモイルオキシ基、N-(2-メチルフエニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基、  
N-(3-メチルフエニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(4-メチルフエ  
ニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(2-メチルー3-クロロフェニル) -  
N-メチルカルバモイルオキシ基、N-(3-メチルー4-クロロフェニル) - N-メチ  
ルカルバモイルオキシ基、N-(2-クロロー4-メチルフエニル) - N-メチルカルバ  
モイルオキシ基、N-(2-メチルー3-フルオロフェニル) - N-メチルカルバモイル  
オキシ基、N-(2-トリフルオロメチルフエニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基  
、N-(4-トリフルオロメチルフエニル) - N-メチルカルバモイルオキシ基、N-フ  
ェニル-N-フェニルカルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-フルオロフェニ  
ル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-フルオロフェニル) カルバモイル  
オキシ基、N-フェニル-N-(4-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フ  
ェニル-N-(2-クロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-  
クロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(4-クロロフェニル) カ  
ルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-ブromoフェニル) カルバモイルオキシ基  
、N-フェニル-N-(3-ブromoフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-  
(4-ブromoフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-ヨードフェ  
ニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-ヨードフェニル) カルバモイル  
オキシ基、N-フェニル-N-(4-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェ  
ニル-N-(2, 3-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-  
(3, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3, 5-  
ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 4-ジフルオロ  
フェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 6-ジフルオロフェニル)  
カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 3-ジクロロフェニル) カルバモイル  
オキシ基、N-フェニル-N-(3, 4-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-  
フェニル-N-(3, 5-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-  
(2, 4-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 6-  
ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3, 4, 5-トリフ  
ルオロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3, 4, 5-トリクロロ  
フェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 4, 6-トリフルオロフェ  
ニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)  
カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-メチルフエニル) カルバモイルオキシ  
基、N-フェニル-N-(3-メチルフエニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-  
(4-メチルフエニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-メチルー  
3-クロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(3-メチルー4-ク  
ロロフェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-クロロー4-メチルフ  
ェニル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-メチルー3-フルオロフェニ  
ル) カルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(2-トリフルオロメチルフエニル) カ  
ルバモイルオキシ基、N-フェニル-N-(4-トリフルオロメチルフエニル) カルバモ  
イルオキシ基、2-ペンタフルオロエチルフエニルカルバモイルオキシ基、3-ペンタフルオロ  
エチルフエニルカルバモイルオキシ基、4-ペンタフルオロエチルフエニルカルバモイル  
オキシ基、2-イソプロピルフエニルカルバモイルオキシ基、3-イソプロピルフエニル  
カルバモイルオキシ基、4-イソプロピルフエニルカルバモイルオキシ基、2-tert  
-ブチルフエニルカルバモイルオキシ基、3-tert-ブチルフエニルカルバモイルオ  
キシ基、4-tert-ブチルフエニルカルバモイルオキシ基、2-sec-ブチルフ  
ェニルカルバモイルオキシ基、3-sec-ブチルフエニルカルバモイルオキシ基、4-s

e c-ブチルフェニルカルバモイルオキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニルカルバモイルオキシ基、4-ペンチルフェニルカルバモイルオキシ基、4-ヘキシルフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルオキシ基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイルオキシ基、2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ基、2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイルオキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイルオキシ基等のカルバモイルオキシ基（アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい）を挙げることができる。

#### 【0102】

カルバモイルオキシ置換C1~6アルキル基（アミノ基上には、C1~6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、カルバモイルオキシメチル基、2-カルバモイルオキシエチル基、1-カルバモイルオキシエチル基、3-カルバモイルオキシプロピル基、4-カルバモイルオキシブチル基、5-カルバモイルオキシペンチル基、6-カルバモイルオキシヘキシル基、フェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-メチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 3-ジメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4-ジメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 6-ジメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 4, 6-トリメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2, 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2

ー (n-プロピルフェニル) カルバモイルオキシメチル基、3- (n-プロピルフェニル) カルバモイルオキシメチル基、4- (n-プロピルフェニル) カルバモイルオキシメチル基、2- (フェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (2, 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、2- (4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、3- (フェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (3-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (2, 3-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (2, 4-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (2, 6-ジトリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (2-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (3-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、3- (4-ペンタフルオロエチルフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、4- (4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) ブチル基、5- (4-トリフルオロメチルフェニルカルバモイルオキシ) ヘキシル基、(2-フルオロフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、2- (3-フルオロフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、1- (4-フルオロフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、3- (2-クロロフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、4- (3-クロロフェニルカルバモイルオキシ) ブチル基、5- (4-クロロフェニルカルバモイルオキシ) ペンチル基、6- (2-ブロモフェニルカルバモイルオキシ) ヘキシル基、(3-ブロモフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、1- (2-ヨードフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、3- (3-ヨードフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、4- (4-ヨードフェニルカルバモイルオキシ) ブチル基、5- (2, 3-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ) ペンチル基、6- (3, 4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ) ヘキシル基、(3, 5-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、2- (2, 4-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、1- (2, 6-ジフルオロフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、3- (2, 3-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、4- (3, 4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ) ブチル基、5- (3, 5-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ) ペンチル基、6- (2, 4-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ) ヘキシル基、(2, 6-ジクロロフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、2- (3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、1- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、3- (3, 4, 5-トリクロロフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、4- (2, 4, 6-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ) ペンチル基、(2-メチル-3-クロロフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、(3-メチル-4-クロロフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、(2-クロロ-4-メチルフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、(2-メチル-3-フルオロフェニルカルバモイルオキシ) メチル基、エチルカルバモイルオキシメチル基、n-ブチルカルバモイルオキシメチル基、n-ヘキシルカルバモイルオキシメチル基、n-ペンチルカルバモイルオキシメチル基、N-メチル-N-フェニルカルバモイルオキシメチル基、N-メチル-N-エチルカルバモイルオキシメチル基、2- [N- (2-フルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、1- [N- (3-フルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、3- [N- (4-フルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プロピル基、4- [N- (2-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ]

ル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N- (3-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ペンチル基、6 - [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N- (4-プロモフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] メチル基、2 - [N- (2-ヨードフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N- (3-ヨードフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、3 - [N- (4-ヨードフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プロピル基、4 - [N- (2, 3-ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N- (3, 4-ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ペンチル基、6 - [N- (3, 5-ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N- (2, 4-ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] メチル基、2 - [N- (2, 6-ジフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N- (2, 3-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、3 - [N- (3, 4-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プロピル基、[N- (3, 5-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] メチル基、4 - [N- (2, 4-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N- (2, 6-ジクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ペンチル基、6 - [N- (3, 4, 5-トリフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N- (3, 4, 5-トリクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] メチル基、2 - [N- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N- (2, 4, 6-トリクロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、3 - [N- (2-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プロピル基、4 - [N- (3-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N- (4-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ヘキシル基、6 - [N- (2-メチル-3-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N- (3-メチル-4-クロロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] メチル基、2 - [N- (2-クロロ-4-メチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N- (2-メチル-3-フルオロフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] エチル基、3 - [N- (2-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プロピル基、4 - [N- (4-トリフルオロメチルフェニル) -N-メチルカルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N-フェニル-N-フェニルカルバモイルオキシ] ペンチル基、6 - [N-フェニル-N- (2-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (3-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2 - [N-フェニル-N- (4-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、1 - [N-フェニル-N- (2-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N-フェニル-N- (3-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3 - [N-フェニル-N- (4-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4 - [N-フェニル-N- (2-プロモフェニル) カルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N-フェニル-N- (3-プロモフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6 - [N-フェニル-N- (4-プロモフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、1 - [N-フェニル-N- (3-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、2 - [N-フェニル-N- (4-ヨードフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N-フェニル-N- (2, 3-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3 - [N-フェニル-N- (3, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4 - [N-フェニル-N- (3, 5-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] プチル基、5 - [N-フェニル-N- (2, 4-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6 - [N-フェニル-N- (2, 6-ジフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2, 3-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2 - [N-フェニル-N- (3, 4-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1 - [N-フェニル-N- (3, 5-ジクロロ

ロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (2, 4-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4- [N-フェニル-N- (2, 6-ジクロロフェニル) カルバモイルオキシ] ブチル基、5- [N-フェニル-N- (3, 4, 5-トリフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (3, 4, 5-トリクロロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2, 4, 6-トリフルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2- [N-フェニル-N- (2, 4, 6-トリクロロフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (2-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (3-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、4-

[N-フェニル-N- (4-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] ブチル基、5- [N-フェニル-N- (2-メチル-3-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] ペンチル基、6- [N-フェニル-N- (3-メチル-4-クロロフェニル) カルバモイルオキシ] ヘキシル基、[N-フェニル-N- (2-クロロ-4-メチルフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、[N-フェニル-N- (2-メチル-3-フルオロフェニル) カルバモイルオキシ] メチル基、2- [N-フェニル-N- (2-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、1- [N-フェニル-N- (3-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイルオキシ] エチル基、3- [N-フェニル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) カルバモイルオキシ] プロピル基、2-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-イソプロピルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-tert-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-sec-ブチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ペンチルフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ヘキシルフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3, 4, 5-トリメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-メトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-メトキシ-3-クロロフェニルカルバモイルオキシメチル基、2- (2-フルオロ-3-メトキシフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、1- (2-フルオロ-4-メトキシフェニルカルバモイルオキシ) エチル基、3- (2, 6-ジメトキシフェニルカルバモイルオキシ) プロピル基、4- (2, 3, 4-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ) ブチル基、5- (3, 4, 5-トリフルオロフェニルカルバモイルオキシ) ペンチル基、6- (2-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシ) ヘキシル基、3-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-トリフルオロメトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-ペンタフルオロエトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-イソプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-tert-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-sec-ブトキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ペンチルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基、4-n-ヘキシルオキシフェニルカルバモイルオキシメチル基等のカルバモイルオキシ置換C1~6アルキル基 (アミノ基上には、C1~6アル



キル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基が 1～5 個、好ましくは 1～3 個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が 1～2 個置換していてもよい) を挙げることができる。

#### 【0103】

ベンゾフリル置換 C 1～6 アルキル基 [ベンゾフラン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい] としては、例えば、2-ベンゾフリルメチル基、1-(2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-ベンゾフリル)エチル基、3-(5-ベンゾフリル)プロピル基、4-(6-ベンゾフリル)ブチル基、5-(7-ベンゾフリル)ペンチル基、6-(2-ベンゾフリル)ヘキシル基、4-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-2-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-2-ベンゾフリルメチル基、4-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-フルオロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、5-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、6-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、7-クロロ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、5-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、6-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、7-ブロモ-3-ベンゾフリルメチル基、4-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、5-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、6-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、7-ヨード-3-ベンゾフリルメチル基、2-(4-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-クロロ-2-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、2-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、2-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(4-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(5-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(6-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、2-(7-クロロ-3-ベンゾフリル)エチル基、6-(5-フルオロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-フルオロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-フルオロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(4-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(5-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-クロロ-2-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(4-フルオロ-3-ベンゾフリル)メチル基、6-(5-フルオロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-フルオロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-フルオロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(4-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(5-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(6-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、6-(7-クロロ-3-ベンゾフリル)ヘキシル基、(2, 4-ジブロモ-3-ベンゾフリル)メチル基、(4, 5, 6-トリクロロ-3-ベンゾフリル)メチル基等のベンゾフラン環上にハロゲン原子が 1～3 個置換していてもよいベンゾフリル置換 C 1～6 アルキル基を挙げることができる。

#### 【0104】

ベンゾチエニル置換 C 1～6 アルキル基 [ベンゾチオフェン環上には、少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい] としては、例えば、2-ベンゾチエニルメチル基

、3-ベンゾチエニルメチル基、4-ベンゾチエニルメチル基、5-ベンゾチエニルメチル基、6-ベンゾチエニルメチル基、7-ベンゾチエニルメチル基、2-(2-ベンゾチエニル)エチル基、3-(2-ベンゾチエニル)プロピル基、4-(2-ベンゾチエニル)ブチル基、5-(2-ベンゾチエニル)ペンチル基、6-(2-ベンゾチエニル)ヘキシル基、5-クロロ-3-ベンゾチエニルメチル基、3, 4-ジプロモ-2-ベンゾチエニルメチル基、4, 5, 6-トリクロロ-2-ベンゾチエニルメチル基等のベンゾチエニル置換C1~6アルキル基〔ベンゾチオフェン環上には、ハロゲン原子が1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

**【0105】**

ナフチル置換C1~6アルキル基としては、例えば、1-ナフチルメチル基、2-ナフチルメチル基、2-(1-ナフチル)エチル基、1-(2-ナフチル)エチル基、3-(1-ナフチル)プロピル基、3-(2-ナフチル)プロピル基、4-(1-ナフチル)ブチル基、4-(2-ナフチル)ブチル基、5-(1-ナフチル)ペンチル基、5-(2-ナフチル)ペンチル基、6-(1-ナフチル)ヘキシル基、6-(2-ナフチル)ヘキシル基等を挙げることができる。

**【0106】**

ピリジル置換C1~6アルキル基〔ピリジン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕としては、例えば、2-ピリジルメチル基、3-ピリジルメチル基、4-ピリジルメチル基、2-(2-ピリジル)エチル基、2-(3-ピリジル)エチル基、2-(4-ピリジル)エチル基、3-(2-ピリジル)プロピル基、3-(3-ピリジル)プロピル基、3-(4-ピリジル)プロピル基、4-(2-ピリジル)ブチル基、4-(3-ピリジル)ブチル基、4-(4-ピリジル)ブチル基、5-(2-ピリジル)ペンチル基、5-(3-ピリジル)ペンチル基、5-(4-ピリジル)ペンチル基、6-(2-ピリジル)ヘキシル基、6-(3-ピリジル)ヘキシル基、6-(4-ピリジル)ヘキシル基、2-クロロ-3-ピリジルメチル基、3-プロモ-2-ピリジルメチル基、4-フルオロ-2-ピリジルメチル基、2-(2-クロロ-4-ピリジル)エチル基、2-(3-クロロ-5-ピリジル)エチル基、2-(4-ヨード-3-ピリジル)エチル基、3-(2-プロモ-5-ピリジル)プロピル基、3-(3-フルオロ-4-ピリジル)プロピル基、3-(4-クロロ-2-ピリジル)プロピル基、4-(2-ヨード-5-ピリジル)ブチル基、4-(3-プロモ-5-ピリジル)ブチル基、4-(4-クロロ-3-ピリジル)ブチル基、5-(2-クロロ-5-ピリジル)ペンチル基、5-(3-フルオロ-2-ピリジル)ペンチル基、5-(4-プロモ-2-ピリジル)ペンチル基、6-(2-クロロ-5-ピリジル)ヘキシル基、6-(3-フルオロ-4-ピリジル)ヘキシル基、6-(4-プロモ-2-ピリジル)ヘキシル基、(2, 6-ジクロロ-4-ピリジル)メチル基、(2, 3, 4-トリクロロ-6-ピリジル)メチル基等のピリジル置換C1~6アルキル基〔ピリジン環上には、置換基としてハロゲン原子が1~3個置換していてもよい〕を挙げることができる。

**【0107】**

フリル置換C1~6アルキル基〔フラン環上には、少なくとも1個のニトロ基が置換していてもよい〕としては、例えば、2-フリルメチル基、3-フリルメチル基、2-(2-フリル)エチル基、3-(2-フリル)プロピル基、3-(3-フリル)プロピル基、4-(2-フリル)ブチル基、4-(3-フリル)ブチル基、5-(2-フリル)ペンチル基、5-(3-フリル)ペンチル基、6-(2-フリル)ヘキシル基、6-(3-フリル)ヘキシル基、5-ニトロ-2-フリルメチル基、5-ニトロ-3-フリルメチル基、2-(5-ニトロ-2-フリル)エチル基、3-(5-ニトロ-2-フリル)プロピル基、4-(5-ニトロ-2-フリル)ブチル基、4-(5-ニトロ-3-フリル)ブチル基、5-(5-ニトロ-2-フリル)ペンチル基、5-(5-ニトロ-3-フリル)ペンチル基、6-(5-ニトロ-2-フリル)ヘキシル基、6-(5-ニトロ-3-フリル)ヘキシル基、(4, 5-ジニトロ-2-フリル)メチル基、(2, 4, 5-トリニトロ-3-フリル)メチル基等のフリル置換C1~6アルキル基〔フラン環上には、置換基としてニトロ

基が1～3個置換していてもよい]を挙げることができる。

#### 【0108】

チエニル置換C1～6アルキル基〔チオフェン環上には、少なくとも1個のハロゲン原子が置換していてもよい〕としては、例えば、2-チエニルメチル基、3-チエニルメチル基、2-(2-チエニル)エチル基、3-(2-チエニル)プロピル基、3-(3-チエニル)プロピル基、4-(2-チエニル)ブチル基、4-(3-チエニル)ブチル基、5-(2-チエニル)ペンチル基、5-(3-チエニル)ペンチル基、6-(2-チエニル)ヘキシル基、6-(3-チエニル)ヘキシル基、5-クロロ-2-チエニルメチル基、5-クロロ-3-チエニルメチル基、2-(4-ブロモ-2-チエニル)エチル基、3-(3-フルオロ-2-チエニル)プロピル基、4-(5-ヨード-2-チエニル)ブチル基、4-(4-クロロ-3-チエニル)ブチル基、5-(3-クロロ-2-チエニル)ペンチル基、5-(2-クロロ-3-チエニル)ペンチル基、6-(3-クロロ-2-チエニル)ヘキシル基、6-(5-クロロ-3-チエニル)ヘキシル基、(4, 5-ジクロロ-2-チエニル)メチル基、(2, 4, 5-トリクロロ-3-チエニル)メチル基等のチエニル置換C1～6アルキル基(チオフェン環上には、置換基としてハロゲン原子が1～3個置換していてもよい)を挙げることができる。

#### 【0109】

フェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)としては、例えば、フェニル基、2-フルオロフェニル基、3-フルオロフェニル基、4-フルオロフェニル基、2-クロロフェニル基、3-クロロフェニル基、4-クロロフェニル基、2-ブロモフェニル基、3-ブロモフェニル基、4-ブロモフェニル基、2-ヨードフェニル基、3-ヨードフェニル基、4-ヨードフェニル基、2, 3-ジフルオロフェニル基、3, 4-ジフルオロフェニル基、3, 5-ジフルオロフェニル基、2, 4-ジフルオロフェニル基、2, 6-ジフルオロフェニル基、2, 3-ジクロロフェニル基、3, 4-ジクロロフェニル基、3, 5-ジクロロフェニル基、2, 4-ジクロロフェニル基、2, 6-ジクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、3, 4, 5-トリクロロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリクロロフェニル基、2-フルオロ-4-ブロモフェニル基、4-クロロ-3-フルオロフェニル基、2, 3, 4-トリクロロフェニル基、3, 4, 5-トリフルオロフェニル基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリメチルフェニル基、4-n-ブチルフェニル基、2, 4-ジメチルフェニル基、2, 3-ジメチルフェニル基、2, 6-ジメチルフェニル基、3, 5-ジメチルフェニル基、2, 5-ジメチルフェニル基、3, 5-ジトリフルオロメチルフェニル基、3-メチル-4-フルオロフェニル基、4-ブロモ-3-トリフルオロメチルフェニル基、2-メチルフェニル基、3-メチルフェニル基、4-メチルフェニル基、2-メチル-3-クロロフェニル基、3-メチル-4-クロロフェニル基、2-クロロ-4-メチルフェニル基、2-メチル-3-フルオロフェニル基、2-トリフルオロメチルフェニル基、3-トリフルオロメチルフェニル基、4-トリフルオロメチルフェニル基、2-ペンタフルオロエチルフェニル基、3-ペンタフルオロエチルフェニル基、4-ペンタフルオロエチルフェニル基、2-イソプロピルフェニル基、3-イソプロピルフェニル基、4-イソプロピルフェニル基、2-tert-ブチルフェニル基、3-tert-ブチルフェニル基、4-tert-ブチルフェニル基、2-sec-ブチルフェニル基、3-sec-ブチルフェニル基、4-sec-ブチルフェニル基、2-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、3-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-n-ヘプタフルオロプロピルフェニル基、4-ペンチルフェニル基、4-ヘキシルフェニル基、2, 3, 4-トリフルオロフェニル基、2, 4, 6-トリフルオロフェニル基等を挙げることができる。

#### 【0110】

チアゾリル置換C1～6アルキル基〔チアゾール環上には、C1～6アルキル基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6

アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい] としては、例えば、4-チアゾリルメチル基、5-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-チアゾリルメチル基、2, 5-ジメチル-4-チアゾリルメチル基、2, 4-ジメチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-チアゾリルメチル基、2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-フェニル-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-ブロモフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-ヨードフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2, 3-ジフルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 4, 6-トリクロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、4-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-フルオロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(2-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(3-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(3-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(2-フルオロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-メチル-4-(4-クロロフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(4-クロロフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-チアゾリル)エチル基、2-(4-チアゾリル)エチル基、2-(5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-4-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-チアゾリル)エチル基、2-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)エチル基、3-(2-チアゾリル)プロピル基、2-(4-チアゾリル)プロピル基、3-(5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、2-(2-メチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル)プロピル基、2-(2-フェニル-4-チアゾリル)プロピル基、3-(3-フェニル-5-チアゾリル)プロピル基、3-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル)プロピル基、4-(2-チア

ゾリル) ブチル基、4-(4-チアゾリル) ブチル基、3-(5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-フェニル-4-チアゾリル) ブチル基、4-(4-フェニル-5-チアゾリル) ブチル基、4-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ブチル基、5-(2-チアゾリル) ペンチル基、5-(4-チアゾリル) ペンチル基、5-(5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-フェニル-4-チアゾリル) ペンチル基、5-(4-フェニル-5-チアゾリル) ペンチル基、5-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ペンチル基、6-(2-チアゾリル) ヘキシル基、6-(4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2, 5-ジメチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2, 4-ジメチル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-5-フェニル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-メチル-4-フェニル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-フェニル-4-チアゾリル) ヘキシル基、6-(4-フェニル-5-チアゾリル) ヘキシル基、6-(2-フェニル-5-メチル-4-チアゾリル) ヘキシル基、2-(2, 3-ジメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基、2-(3-メチルフェニル)-5-チアゾリルメチル基、2-(3-トリフルオロメチルフェニル)-5-メチル-4-チアゾリルメチル基、2-(3-エチルフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-(2-トリフルオロエチルフェニル)-4-メチル-5-チアゾリルメチル基、2-メチル-5-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-4-チアゾリルメチル基等のチアゾリル置換C1~6アルキル基[チアゾール環上には、C1~6アルキル基及びフェニル基(フェニル環上には、ハロゲン原子及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい)からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい]を挙げることができる。

#### 【0111】

テトラゾリル置換C1~6アルキル基[テトラゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい]としては、例えば、5-(1H)-テトラゾリルメチル基、2-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、1-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、4-(5-(1H)-テトラゾリル)ブチル基、5-(5-(1H)-テトラゾリル)ペンチル基、6-(5-(1H)-テトラゾリル)ヘキシル基、2-メチル-3-(5-(1H)-テトラゾリル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、1-メチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-エチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-プロピル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-ブチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、1-ヘキシル-5-(1H)-テトラゾリルメチル基、2-(1-メチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-エチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-プロピル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ブチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基、2-(1-ペンチル-5-(1H)-テトラゾリル)エチル基等のテトラゾリル置換C1~6アルキル基[テトラゾール環上には、少なくとも1個のC1~6アルキル基が置換していてもよい]を挙げることができる。

#### 【0112】

イソオキサゾリル置換C1～6アルキル基 [イソオキサゾール環上には、少なくとも1個のC1～6アルキル基が置換していてもよい] としては、例えば、(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)メチル基、2-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)エチル基、1-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)エチル基、3-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)プロピル基、4-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)ブチル基、5-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)ペンチル基、6-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)ヘキシル基、3-メチル-2-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)プロピル基、1, 1-ジメチル-2-(3-, 4-又は5-イソオキサゾリル)エチル基、(3-メチル-4-イソオキサゾリル)メチル基、(4-エチル-3-イソオキサゾリル)メチル基、(5-プロピル-3-イソオキサゾリル)メチル基、(4-n-ブチル-5-イソオキサゾリル)メチル基、(5-n-ペンチル-3-イソオキサゾリル)メチル基、(3-n-ヘキシル-4-イソオキサゾリル)メチル基、(3, 4-ジメチル-5-イソオキサゾリル)メチル基、2-(3-メチル-4-イソオキサゾリル)エチル基、1-(4-エチル-3-イソオキサゾリル)エチル基、3-(5-プロピル-3-イソオキサゾリル)プロピル基、4-(4-n-ブチル-5-イソオキサゾリル)ブチル基、5-(5-n-ペンチル-3-イソオキサゾリル)ペンチル基、6-(3-n-ヘキシル-4-イソオキサゾリル)ヘキシル基、2-(3, 4-ジメチル-5-イソオキサゾリル)エチル基等のイソオキサゾリル置換C1～6アルキル基 [イソオキサゾール環上には、C1～6アルキル基が1～2個置換していてもよい] を挙げることができる。

#### 【0113】

1, 2, 4-オキサジアゾリル置換C1～6アルキル基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基 (フェニル環上には、C1～6のアルキル基が置換していてもよい) が置換していてもよい] としては、例えば、(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリルメチル基、2-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、1-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、3-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]プロピル基、4-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]ブチル基、5-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]ペンチル基、6-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]ヘキシル基、3-メチル-2-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]プロピル基、1, 1-ジメチル-2-[(3-又は5-) 1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、(3-フェニル-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル)メチル基、(5-フェニル-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル)メチル基、[3-(3-メチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、[5-(3, 4-ジメチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、[3-(2, 4, 6-トリメチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、[5-(2-エチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]メチル基、2-[(3-n-プロピルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、1-[5-(4-n-ブチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]エチル基、3-[3-(3-n-ペンチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]プロピル基、4-[5-(5-n-ヘキシルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]ブチル基、5-[3-(3-エチル-4-メチルフェニル)-5-1, 2, 4-オキサジアゾリル]ペンチル基、6-[5-(2-メチルフェニル)-3-1, 2, 4-オキサジアゾリル]ヘキシル基等の1, 2, 4-オキサジアゾリル置換C1～6アルキル基 [1, 2, 4-オキサジアゾール環上には、少なくとも1個のフェニル基 (フェニル環上には、C1～6のアルキル基が1～3個置換していてもよい) が置換していてもよい] を挙げることができる。

#### 【0114】

ベンゾフラザニル置換C1～6アルキル基としては、例えば、4-ベンゾフラザニルメチル、5-ベンゾフラザニルメチル、6-ベンゾフラザニルメチル、7-ベンゾフラザニルメチル、1-(4-ベンゾフラザニル)エチル、2-(5-ベンゾフラザニル)エチル、3-(6-ベンゾフラザニル)プロピル、4-(7-ベンゾフラザニル)ブチル、5-

(4-ベンゾフラザニル)プロピル、6-(5-ベンゾフラザニル)ヘキシル、2-メチル-3-(6-ベンゾフラザニル)プロピル、1,1-ジメチル-2-(7-ベンゾフラザニル)エチル基等を挙げることができる。

#### 【0115】

フェニルアミノ基〔フェニルアミノ基のN位にはC1～6アルキル基が置換していてもよく、フェニルアミノ基のフェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい〕としては、無置換のフェニルアミノ基(別名:アニリノ基)又は上記で定義したハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が1ないし3個置換したフェニルアミノ基であって、例えば、フェニルアミノ基、2-メトキシフェニルアミノ基、3-メトキシフェニルアミノ基、4-メトキシフェニルアミノ基、2-エトキシフェニルアミノ基、3-エトキシフェニルアミノ基、4-エトキシフェニルアミノ基、4-プロポキシフェニルアミノ基、4-tert-ブトキシフェニルアミノ基、4-ブトキシフェニルアミノ基、2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ基、3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ基、4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ基、2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ基、3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ基、2,3-ジメトキシフェニルアミノ基、3,4,5-トリメトキシフェニルアミノ基、4-n-ペンチルオキシフェニルアミノ基、4-n-ヘキシルオキシフェニルアミノ基、3,5-ジトリフルオロメトキシフェニルアミノ基、N-フェニル-N-メチルアミノ基、N-(2-メトキシフェニル)-N-エチルアミノ基、N-(3-メトキシフェニル)-N-n-プロピルアミノ基、N-(4-メトキシフェニル)-N-n-ブチルアミノ基、N-(2-エトキシフェニル)-N-n-ペンチルアミノ基、N-(3-エトキシフェニル)-N-n-ヘキシルアミノ基、N-(4-エトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(4-プロポキシフェニル)-N-エチルアミノ基、N-(4-tert-ブトキシフェニル)-N-n-プロピルアミノ基、N-(4-n-ブトキシフェニル)-N-n-ブチルアミノ基、N-(2-トリフルオロメトキシフェニル)-N-n-ペンチルアミノ基、N-(3-トリフルオロメトキシフェニル)-N-n-ヘキシルアミノ基、N-(4-トリフルオロメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(2-ペンタフルオロエトキシフェニル)-N-エチルアミノ基、N-(3-ペンタフルオロエトキシフェニル)-N-n-プロピルアミノ基、N-(2,3-ジメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(3,4,5-トリメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(4-n-ペンチルオキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(4-n-ヘキシルオキシフェニル)-N-メチルアミノ基、N-(3,5-ジトリフルオロメトキシフェニル)-N-メチルアミノ基等を挙げることができる。

#### 【0116】

フェノキシ基(フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい。)としては、例えば、フェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2,4-ジメトキシフェノキシ基、2,3-ジメトキシフェノキシ基、2,3,4,5,6-ペンタメトキシフェノキシ基、3,5-ジメトキシフェノキシ基、2,5-ジメトキシフェノキシ基、2,4,6-トリメトキシフェノキシ基、3,5-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2,6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2,3-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2,4-ジ(トリフルオロメトキシ)フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシ

シフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基等のフェノキシ基（フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい）を挙げることができる。

#### 【0117】

アミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）としては、例えば、アミノ基、メチルアミノ基、ジメチルアミノ基、エチルアミノ基、ジエチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、n-ブチルアミノ基、n-ペンチルアミノ基、3-n-ヘキシルアミノ基、フェニルアミノ基、（4-クロロフェニル）アミノ基、（4-プロモフェニル）アミノ基、（2, 4-ジクロロフェニル）アミノ基、（2, 4, 6-トリクロロフェニル）アミノ基、（2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニル）アミノ基、（4-フルオロフェニル）アミノ基、（4-ヨードフェニル）アミノ基、（4-クロロフェニル）アミノ基、（3-メチルフェニル）アミノ基、（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、3-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、（3, 4-ジメチルフェニル）アミノ基、（3, 4, 5-トリメチルフェニル）アミノ基、（2-メトキシフェニル）アミノ基、（4-トリフルオロメトキシフェニル）アミノ基、3-（4-トリフルオロメトキシフェニル）アミノ基、（3, 5-ジメトキシフェニル）アミノ基、（2, 5-ジメトキシフェニル）アミノ基、（2, 4, 6-トリメトキシフェニル）アミノ基、N-メチル-N-（4-トリフルオロメチルフェニル）アミノ基、N-エチル-N-（4-トリフルオロメトキシフェニル）アミノ基等のアミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基が1～2個置換していてもよい）を挙げることができる。

#### 【0118】

ピペリジル基〔ピペリジン環上には、フェノキシ基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基が置換していてもよい）及びアミノ基（該アミノ基上には、置換基としてC1～6アルキル基及びフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換C1～6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕としては、例えば、2-ピペリジル基、3-ピペリジル基、4-ピペリジル基、2, 4-ジアミノ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリアミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-3-フェノキシ-1-ピペリジル基、4-フェノキシ-2-アミノ-1-ピペリジル基、2-アミノ-1-ピペリジル基、3-アミノ-1-ピペリジル基、4-アミノ-1-ピペリジル基、4-メチルアミノ-1-ピペリジル基、4-エチルアミノ-1-ピペリジル基、4-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジメチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジエチルアミノ-1-ピペリジル基、4-ジ-n-プロピルアミノ-1-ピペリジル基、4-フェニルアミノ-1-ピペリジル基、4-（N-フェニル-N-メチルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（2-フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（3-フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（4-フルオロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（2-クロロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（3-クロロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（4-クロロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（2, 3-ジクロロフェニルアミノ）-1-ピペリジル基、4-（2, 4, 6-



トリフルオロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2, 4-ジクロロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (3, 4-ジクロロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (3, 5-ジクロロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2, 3, 4, 5, 6-ペンタフルオロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-メチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2, 3-ジメチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2, 4, 6-トリメチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (4-トリフルオロメチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (3-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (4-ペンタフルオロエチルフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-メトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2, 3-ジメトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - [N-メチル-N-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルアミノ)] - 1-ピペリジル基、4 - [N-メチル-N-(3, 4-ジメチルフェニルアミノ)] - 1-ピペリジル基、4 - (3-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (3-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (4-ペンタフルオロエトキシフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (2-フルオロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (3-フルオロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - (4-フルオロフェニルアミノ) - 1-ピペリジル基、4 - フェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4-ジフェノキシ-1-ピペリジル基、2, 4, 6-トリフェノキシ-1-ピペリジル基、4 - (2-メトキシフェノキシ) - 1-ピペリジル基、1 - (3-メトキシフェノキシ) - 4-ピペリジル基、1 - (4-メトキシフェノキシ) - 4-ピペリジル基、2 - (2-エトキシフェノキシ) - 3-ピペリジル基、3 - (3-エトキシフェノキシ) - 4-ピペリジル基、4 - (4-エトキシフェノキシ) - 5-ピペリジル基、3 - (4-n-プロポキシフェノキシ) - 2-ピペリジル基、2 - (4-tert-ブトキシフェノキシ) - 1-ピペリジル基、1 - (4-n-ブトキシフェノキシ) - 2-ピペリジル基、2 - (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3-ピペリジル基、3 - (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 4-ピペリジル基、4 - (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) - 3-ピペリジル基、3 - (2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 2-ピペリジル基、6 - (3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) - 1-ピペリジル基、1 - (2, 3-ジメトキシフェノキシ) - 4-ピペリジル基、4 - (3, 4, 5-トリメトキシフェノキシ) - 1-ピペリジル基、4 - (4-n-ペンチルオキシフェノキシ) - 4 - (4-n-ヘキシルオキシフェノキシ) - 1-ピペリジル基等のピペリジル基 [ピペリジン環上には、フェノキシ基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい) 及びアミノ基 (該アミノ基上には、置換基としてC1~6アルキル基及びフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1~5個、好ましくは1~3個置換していてもよい] からなる群より選ばれた基が1~2個置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1~3個置換していてもよい] を挙げることができる。

#### 【0119】

フェノキシ置換フェニル基 (フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が置換していてもよい) としては、例えば、2-フェノキシフェニル基、2, 3-ジフェノキシフェニル基、2, 4, 6-トリフェノキシフェニル基、3 - (2-メトキシフェノキシ) フェニル基、4 - (3-メトキシフェノキシ) フェニル基、2 - (4-メトキシフェノキシ) フェニル基、3 - (4-イソプロポキシフェ

ノキシ) フェニル基、4-(4-n-ブトキシフェノキシ) フェニル基、2-(2, 4-ジメトキシフェノキシ) フェニル基、3-(2, 3-ジメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2, 3, 4, 5, 6-ペンタメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3, 5-ジメトキシフェノキシ) フェニル基、3-(2, 5-ジメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) フェニル基、2-[3, 5-ジ(トリフルオロメトキシ) フェノキシ] フェニル基、3-(4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2, 6-ジメトキシフェノキシ) フェニル基、2-(2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、3-(3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル基、2-[2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ) フェノキシ] フェニル基、3-[2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ) フェノキシ] フェニル基、4-(2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル基、3-(4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2-イソプロポキシフェノキシ) フェニル基、2-(3-イソプロポキシフェノキシ) フェニル基、3-(4-イソプロポキシフェノキシ) フェニル基、4-(2-tert-ブトキシフェノキシ) フェニル基、2-(3-tert-ブトキシフェノキシ) フェニル基、3-(4-tert-ブトキシフェノキシ) フェニル基、4-(2-sec-ブトキシフェノキシ) フェニル基、3-(3-sec-ブトキシフェノキシ) フェニル基、4-(4-sec-ブトキシフェノキシ) フェニル基、2-(4-n-ヘキシルオキシフェノキシ) フェニル基、3-(2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ) フェニル基、4-(3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ) フェニル基、2-(4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ) フェニル基等のフェノキシ置換フェニル基(フェニル環上には、1~5個のハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が置換していてもよい)を挙げることができる。

#### 【0120】

フェノキシ基[フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基(フェニル環上には、少なくとも1個のハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が置換していてもよい)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい]としては、例えば、フェノキシ基、2-メトキシフェノキシ基、3-メトキシフェノキシ基、4-メトキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、4-n-ブトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシフェノキシ基、2, 3-ジメトキシフェノキシ基、2, 3, 4, 5, 6-ペンタメトキシフェノキシ基、3, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 5-ジメトキシフェノキシ基、2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ基、3, 5-ジ(トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 6-ジメトキシフェノキシ基、2-トリフルオロメトキシフェノキシ基、3-トリフルオロメトキシフェノキシ基、4-トリフルオロメトキシフェノキシ基、2, 3-ジ(トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、2, 4-ジ(トリフルオロメトキシ) フェノキシ基、2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ基、2-イソプロポキシフェノキシ基、3-イソプロポキシフェノキシ基、4-イソプロポキシフェノキシ基、2-tert-ブトキシフェノキシ基、3-tert-ブトキシフェノキシ基、4-tert-ブトキシフェノキシ基、2-sec-ブトキシフェノキシ基、3-sec-ブトキシフェノキシ基、4-sec-ブトキシフェノキシ基、4-n-ヘキシルオキシフェノキシ基、2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ基、2-(2-フェノキシフェニル) フェノキシ基、2, 3-ジ(2-フェノキシフェニル) フェノキシ基、2, 3-ジ(2-フェノキシフェニル)-4-メトキシフェノキシ基、2, 4-ジメトキシ-3-(3-フェノキシフェニル) フェノキシ基、3-(2, 3-ジフェノキシフェニル) フェノキシ基、4-(2, 4, 6-トリフェノキシフェニル) フェノキシ基、2-[3-(2-メトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3-[

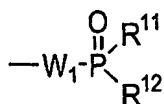
4- (3-メトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (4-メトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (4-イソプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (4-n-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (2, 4-ジメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (2, 3-ジメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (2, 3, 4, 5, 6-ペンタメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (3, 5-ジメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (2, 5-ジメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (2, 4, 6-トリメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- [3, 5-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ] フェニル] フェノキシ基、2- [3- (4-メトキシ-3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (2, 6-ジメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (2-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (3-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (4-トリフルオロメトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- [2, 3-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ] フェニル] フェノキシ基、2- [3- [2, 4-ジ (トリフルオロメトキシ) フェノキシ] フェニル] フェノキシ基、3- [4- (2-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (3-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (4-ペンタフルオロエトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (2-イソプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (3-イソプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (4-イソプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [2- (2-tert-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (3-tert-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (4-tert-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (2-sec-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [2- (3-sec-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (4-sec-ブトキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (4-n-ヘキシルオキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、2- [3- (2-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、3- [4- (3-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基、4- [2- (4-n-ヘプタフルオロプロポキシフェノキシ) フェニル] フェノキシ基等のフェノキシ基 [フェニル環上には、ハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基及びフェノキシ置換フェニル基 (フェニル環上には、1~5個のハロゲン置換もしくは未置換のC1~6アルコキシ基が置換していてもよい) からなる群より選ばれた基が1~5個置換していてもよい] を挙げることができる。

#### 【0121】

フェニル基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基、置換基としてC1~6アルカノイル基及びC1~6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基; C1~6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基が少なくとも1個置換していてもよい)、C1~6アルキルスルホニル基、C3~8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C1~6アルキルチオ基、フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)、水酸基置換C1~6アルキル基及び基

#### 【0122】

## 【化10】

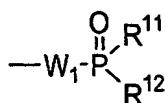


## 【0123】

(式中、 $W_1$ はC1～6アルキレン基を示す。 $R^{11}$ 及び $R^{12}$ は、同一又は異なって、C1～6アルコキシ基を示す。) からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい) としては、前記のハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基、置換基としてC1～6アルカノイル基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を1～2個有することのあるアミノ基、C1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が1～2個置換していてもよい)、C1～6アルキルスルホニル基、C3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C1～6アルキルチオ基、フェニルスルホニル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基が1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよい)、水酸基置換C1～6アルキル基及び基

## 【0124】

## 【化11】



## 【0125】

(式中、 $W_1$ はC1～6アルキレン基を示す。 $R^{11}$ 及び $R^{12}$ は、同一又は異なって、C1～6アルコキシ基を示す。) からなる群より選ばれた基がフェニル環の2～6位に、1～5個、好ましくは1～3個置換していてもよいフェニル基を例示できる。

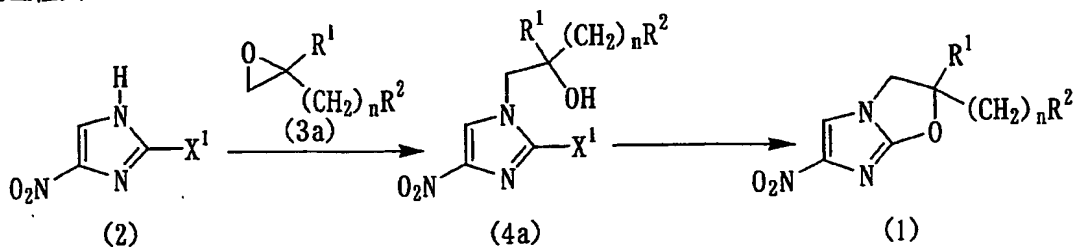
## 【0126】

本発明の化合物の製造方法につき、以下に詳述する。

## 【0127】

## 【化12】

## 反応工程式-1



## 【0128】

[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $n$ は前記に同じ。 $X^1$ はハロゲン原子又はニトロ基を示す。]

反応工程式-1によれば、一般式(1)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下又は非存在下に、一般式(2)で表される4-ニトロイミダゾール化合物と一般式(3a)で表されるエポキシ化合物とを反応させて一般式(4a)で表される化合物を得、

次いで得られた一般式(4a)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

【0129】

一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との使用割合は、通常前者に対して後者を0.5~5倍モル、好ましくは0.5~3倍モルとするのがよい。

【0130】

塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば金属水素化物、金属アルコール、水酸化物、炭酸塩、炭酸水素塩等の無機塩基性化合物及び酢酸塩等の有機塩基性化合物が挙げられる。

【0131】

金属水素化物としては、具体的には、水素化ナトリウム、水素化カリウム等を例示できる。金属アルコールとしては、具体的には、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウムtert-ブトキシド等を例示できる。水酸化物としては、具体的には、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等を例示できる。炭酸塩としては、具体的には、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等を例示できる。炭酸水素塩としては、具体的には、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等を例示できる。無機塩基性化合物には、上記以外に、ナトリウムアミド等も包含される。

【0132】

酢酸塩としては、具体的には、酢酸ナトリウム、酢酸カリウム等を例示できる。上記以外の有機塩基性化合物としては、具体的には、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、1-メチルピロリジン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等を例示できる。

【0133】

斯かる塩基性化合物は、一般式(2)の化合物に対して、通常0.1~2倍モル、好ましくは0.1倍~等モル、より好ましくは0.1~0.5倍モル用いるのがよい。

【0134】

一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応は、通常、適当な溶媒中で行われる。

【0135】

溶媒としては、反応を阻害しない溶媒であれば公知のものを広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、ジメチルホルムアミド(DMF)、ジメチルスルホキシド(DMSO)、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン系溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、メタノール、エタノール、イソプロパノール、n-ブタノール、tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、テトラヒドロフラン(THF)、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル系溶媒、これらの混合溶媒等が挙げられる。これらの溶媒は、水が含まれていてもよい。

【0136】

一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応は、例えば、一般式(2)の化合物を反応溶媒に溶解し、攪拌しながら氷冷下乃至は室温(30℃)で塩基性化合物を加え、室温~80℃で30分~1時間攪拌した後、一般式(3a)の化合物を加え、通常室温~100℃、好ましくは50~80℃で30分~60時間、好ましくは1~50時間攪拌を続けることにより行われる。

【0137】

原料として用いられる化合物(2)は公知化合物である。化合物(3a)は、新規化合物を包含し、該化合物の製造方法については後述する。

【0138】

一般式(1)で表される本発明化合物は、一般式(4a)で表される化合物を閉環反応

に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式(4a)で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加えて攪拌することにより行われる。

【0139】

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

【0140】

塩基性化合物の使用量は、一般式(4a)の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

【0141】

閉環反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは50～100℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～12時間である。

【0142】

本発明では、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応により生成する一般式(4a)の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができる。例えば、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物とを室温～80℃で反応させた後、反応混合物に塩基性化合物を添加し、50～100℃で更に攪拌を行うか、又は一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物とを室温～80℃で反応させた後、反応混合物を濃縮し、残留物を高沸点溶媒に溶解し、得られる溶液に塩基性化合物を添加し、50～100℃で更に攪拌を行うことにより、一般式(1)で表される目的化合物を製造することもできる。

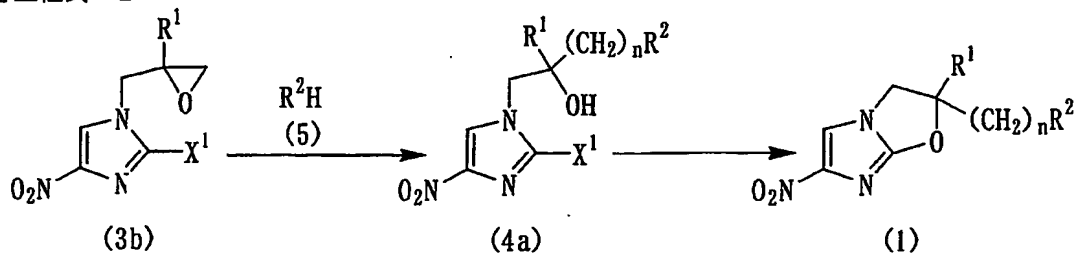
【0143】

また、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応において、塩基性化合物を化合物(2)に対して0.9～2倍モル用い、50～100℃で攪拌することにより、一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応を一挙に行い、一般式(1)で表される目的化合物を製造することもできる。

【0144】

【化13】

反応工程式-2



【0145】

[式中、R¹、R²及びX¹は前記に同じ。]

反応工程式-2によれば、一般式(1)で表される本発明化合物は、塩基性化合物の存在下に、一般式(3b)で表される化合物と一般式(5)で表される化合物又はその塩とを反応させて一般式(4a)で表される化合物を得、次いで得られた一般式(4a)で表される化合物を閉環させることにより製造される。

【0146】

化合物(3b)は新規化合物であり、該化合物の製造方法については後述する(反応工程式-6)。また、化合物(5)は、新規化合物を包含しており、該化合物の製造方法の一例を後記参考例2に示す。

【0147】

一般式(3b)の化合物と一般式(5)の化合物との使用割合は、通常前者に対して後

者を 0.5～5 倍モル、好ましくは 0.5～2 倍モルとするのがよい。

【0148】

一般式 (3b) の化合物と一般式 (5) の化合物との反応は、塩基性化合物の存在下、適当な溶媒中で行われる。

【0149】

塩基性化合物及び反応溶媒としては、上記一般式 (2) の化合物と一般式 (3a) の化合物との反応で用いられる塩基性化合物及び反応溶媒と同じものを使用できる。塩基性化合物の使用量は、一般式 (3b) の化合物に対して、通常触媒量、好ましくは 0.1～3 倍モル、より好ましくは 0.1～2 倍モルである。

【0150】

化合物 (5) と塩基性化合物とを用いる代わりに、該化合物 (5) の塩を使用することができる。斯かる塩としては、化合物 (5) のナトリウム塩、カリウム塩等のアルカリ金属塩が挙げられる。

【0151】

一般式 (3b) の化合物と一般式 (5) の化合物との反応は、通常室温～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは室温～80℃で行われる。反応時間は、通常 10 分～48 時間、好ましくは 10 分～24 時間、より好ましくは 10 分～2 時間である。

【0152】

一般式 (1) で表される本発明化合物は、一般式 (4a) で表される化合物を閉環反応に供することにより製造される。閉環反応は、上記で得られた一般式 (4a) で表される化合物を反応溶媒に溶解し、塩基性化合物を加え、所定の温度にて攪拌することにより行われる。

【0153】

反応溶媒及び塩基性化合物としては、上記一般式 (3b) の化合物と一般式 (5) の化合物との反応で用いられる反応溶媒及び塩基性化合物と同じものを使用できる。

【0154】

塩基性化合物の使用量は、一般式 (4a) の化合物に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～5 倍モル、より好ましくは等モル～2 倍モルである。

【0155】

閉環反応の反応温度は、通常 0～150℃、好ましくは室温～120℃、より好ましくは 50～100℃である。反応時間は、通常 10 分～48 時間、好ましくは 10 分～24 時間、より好ましくは 20 分～4 時間である。

【0156】

本発明では、一般式 (3b) の化合物と一般式 (5) の化合物との反応により生成する一般式 (4a) の化合物を単離することなく、反応混合物をそのまま引き続く閉環反応に供することができ、斯くして目的とする一般式 (1) で表される本発明化合物を製造することもできる。

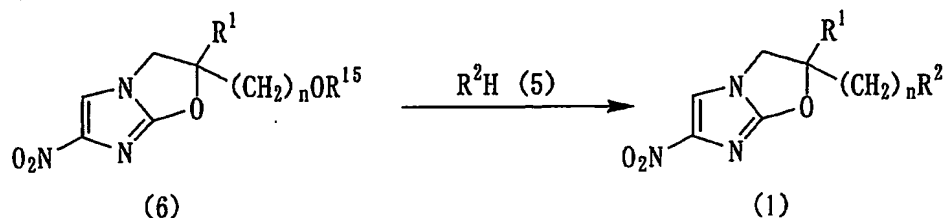
【0157】

塩基性化合物を化合物 (5) に対して等モル～過剰モル使用し、50～100℃で反応を行えば、中間体 (4a) が単離されずに、一般式 (1) の本発明化合物が一挙に製造される。化合物 (5) のアルカリ金属塩 (例えば、ナトリウム塩、カリウム塩) を用いた場合も同様である。

【0158】

## 【化 1 4】

## 反応工程式-3



## 【0159】

[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $n$ は前記に同じ。 $R^{15}$ は、C1～6アルキルスルホニル基、又はC1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基を示す。]

ここで、C1～6アルキルスルホニル基とは、炭素数1ないしは6個で構成されるアルキル基とスルホニル基で構成される基であって、例えば、メタンスルホニル基、エタンスルホニル基、プロパンスルホニル基、ブタンスルホニル基、ペンタンスルホニル基、ヘキサンスルホニル基等を挙げることができる。

## 【0160】

C1～6アルキル基が置換していてもよいベンゼンスルホニル基としては、例えば、ベンゼンスルホニル基、*o*-トルエンスルホニル基、*m*-トルエンスルホニル基、*p*-トルエンスルホニル基、2-エチルベンゼンスルホニル基、3-エチルベンゼンスルホニル基、4-エチルベンゼンスルホニル基、2-プロピルベンゼンスルホニル基、3-プロピルベンゼンスルホニル基、4-プロピルベンゼンスルホニル基、2,3-ジメチルベンゼンスルホニル基、2,4-ジメチルベンゼンスルホニル基、2,4,6-トリメチルベンゼンスルホニル基等のC1～6アルキル基が1～3個置換していてもよいベンゼンスルホニル基を挙げることができる。

## 【0161】

化合物(6)と化合物(5)との反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

## 【0162】

使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒である限り公知の溶媒をいずれも使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、エタノール、イソプロパノール、*n*-ブタノール、*tert*-ブタノール等のアルコール系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

## 【0163】

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

## 【0164】

塩基性化合物の使用量は、化合物(6)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

## 【0165】

化合物(5)は、化合物(6)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは0.9～2倍モル、より好ましくは0.9～1.5倍モル使用すればよい。

## 【0166】

反応温度は、通常室温～150℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは60～100℃である。反応時間は、通常10分～24時間、好ましくは10分～12時間、よ



り好ましくは20分～7時間である。

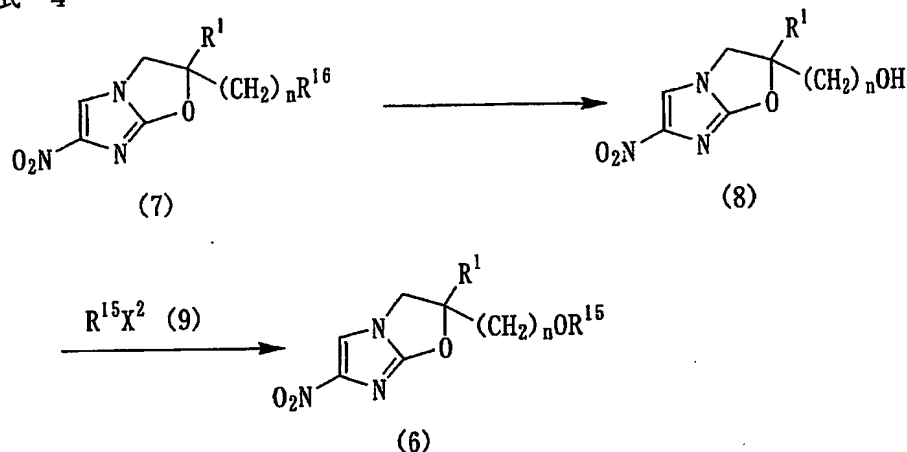
【0167】

次に、本発明化合物を製造するための出発原料及び中間体の製造方法につき説明する。

【0168】

【化15】

反応工程式-4



【0169】

[式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^{15}$ 及び $n$ は前記に同じ。 $\text{R}^{16}$ はC1～6アルコキシ-C1～6アルコキシ基又はC1～6アルカノイルオキシ基を示す。 $\text{X}^2$ はハロゲン原子を示す。]

化合物(8)は、化合物(7)を加水分解することにより製造される。

【0170】

該加水分解反応は、酸性条件下で行われる。例えば、化合物(7)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、酸を加え、0～120℃で攪拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、アセトニトリル、アセトン、トルエン、DMF、DMSO、酢酸、トリフルオロ酢酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。使用される酸は、例えばトリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸及び塩酸、臭素酸、臭化水素酸、硫酸等の無機酸を挙げることができる。トリフルオロ酢酸、酢酸等の有機酸は、それ自身反応溶媒としても使用できる。反応温度は、通常0～120℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは室温～80℃である。反応時間は、通常30分～24時間、好ましくは30分～12時間、より好ましくは1～8時間である。

【0171】

化合物(7)の加水分解は、また、塩基性条件下でも行われることができる。例えば、化合物(7)を適当な溶媒に懸濁又は溶解した液に、塩基を加え、0～120℃で攪拌することにより行われる。使用される溶媒は、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、エチレングリコール等のアルコール系溶媒、又はこれらの混合溶媒である。使用される塩基は、例えば、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム等のアルカリ金属水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等のアルカリ金属炭酸化物、酢酸ナトリウム等の酢酸塩等を挙げることができる。反応温度は、0～120℃、好ましくは室温～100℃、より好ましくは室温～80℃である。反応時間は、30分～24時間、好ましくは30分～12時間、より好ましくは1～8時間である。

【0172】

化合物(8)と化合物(9)との反応には、一般に行われているアルコールのスルホニル化反応の反応条件を広く適用できる。例えば、化合物(8)を適当な溶媒に溶解し、この溶液に塩基性化合物の存在下、化合物(9)を加え、0～150℃で攪拌することによって化合物(6)を得ることができる。

## 【0173】

使用される溶媒としては、スルホニル化反応を阻害しない溶媒であれば公知の溶媒をいずれも使用できる。このような溶媒としては、例えば、塩化メチレン、クロロホルム等のハロゲン化炭化水素系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素系溶媒、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、酢酸エチル、アセトン等、又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

## 【0174】

化合物(9)は、化合物(8)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは等モル～2倍モル、より好ましくは等モル～1.1倍モル使用すればよい。

## 【0175】

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

## 【0176】

塩基性化合物の使用量は、化合物(8)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モルである。

## 【0177】

本スルホニル化反応では、4-ジメチルアミノピリジン、4-(1-ピロリジニル)ピリジン等を触媒として使用することもできる。

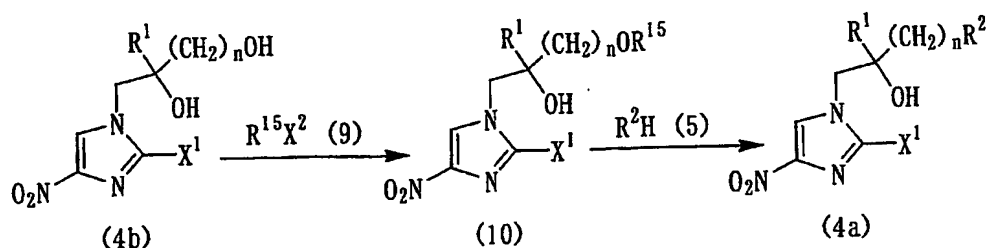
## 【0178】

反応温度は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃、より好ましくは0～60℃である。反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～4時間である。

## 【0179】

## 【化16】

反応工程式-5



## 【0180】

[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>15</sup>、X<sup>1</sup>及びnは前記に同じ。]

化合物(4b)から化合物(10)に導く反応は、例えば、反応工程式-4における化合物(8)から化合物(6)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

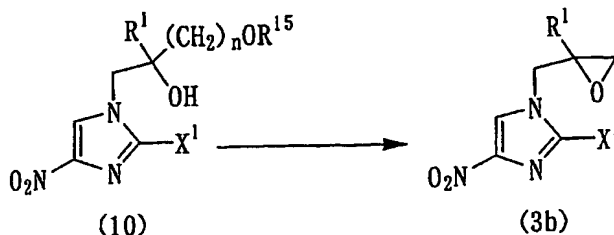
## 【0181】

化合物(10)から化合物(4a)に導く反応は、例えば、反応工程式-3における化合物(6)から化合物(1)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

## 【0182】

## 【化 17】

## 反応工程式-6



## 【0183】

[式中、 $R^1$ 、 $R^{15}$ 、 $X^1$ 及び $n$ は前記に同じ。]

化合物(10)から化合物(3b)に導く反応は、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下で行われる。

## 【0184】

ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、アセトン、酢酸エチル又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

## 【0185】

塩基性化合物としては、上記一般式(2)の化合物と一般式(3a)の化合物との反応で用いられる塩基性化合物と同じものを使用できる。

## 【0186】

塩基性化合物は、化合物(10)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～5倍モル、より好ましくは1～2倍モル用いるのがよい。

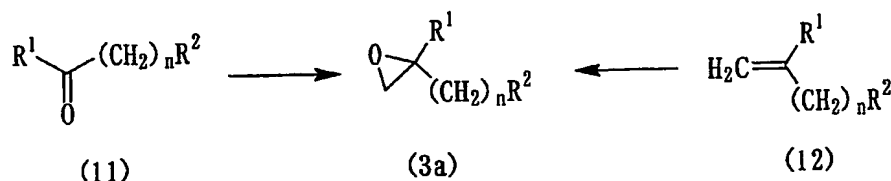
## 【0187】

この反応の反応温度は、通常0～150℃、好ましくは0～100℃、より好ましくは0～60℃である。また、反応時間は、通常30分～48時間、好ましくは1～24時間、より好ましくは1～4時間である。

## 【0188】

## 【化 18】

## 反応工程式-7



## 【0189】

[式中、 $R^1$ 、 $R^2$ 及び $n$ は前記に同じ。]

化合物(11)から化合物(3a)に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に、化合物(11)をトリメチルスルホキソニウムヨージドで処理することにより行われる。

## 【0190】

ここで使用できる溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒と

しては、例えば、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン等の炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0191】

塩基性化合物としては、水素化ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメトキシド、ナトリウムエトキシド、カリウム *tert*-ブトキシド等の金属アルコラート等を挙げることができる。

【0192】

これらの塩基性化合物は、化合物(11)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～3倍モル、より好ましくは1～1.5倍モル用いるのがよい。

【0193】

また、トリメチルスルホキソニウムヨージドは、化合物(11)に対して、通常等モル～過剰モル、好ましくは1～3倍モル、より好ましくは1～1.5倍モル用いるのがよい。

【0194】

この反応の反応温度は、通常0～80℃、好ましくは10～50℃、より好ましくは20～35℃である。また、反応時間は、通常1～24時間、好ましくは1～12時間、より好ましくは1～4時間である。

【0195】

化合物(12)から化合物(3a)に導く反応は、例えば、適当な溶媒中、化合物(12)を過酸化物で処理することにより行われる。

【0196】

ここで使用できる反応溶媒は、反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール等のアルコール系溶媒、DMF、DMSO、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグライム等のエーテル系溶媒、又は上記混合溶媒等を挙げることができる。

【0197】

過酸化物としては、例えば、メタクロロ過安息香酸(mCPBA)、過安息香酸、過酢酸、過酸化水素等が挙げられる。

【0198】

これら過酸化物は、化合物(12)に対して、通常等モル～2倍モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.3倍モル使用すればよい。

【0199】

この反応の反応温度は、通常0～80℃、好ましくは0～50℃、より好ましくは20～35℃である。また、反応時間は、通常10分～24時間、好ましくは1～12時間、より好ましくは1～8時間である。

【0200】

光学活性な化合物(3a)は、例えば、化合物(12)から次のようにして製造される。

【0201】

光学活性な化合物(3a)は、上記化合物(12)から化合物(3a)に導く反応において用いられる過酸化物に代えてクメンヒドロパーオキシド又は *tert*-ブチルヒドロペルオキシドを用い、触媒(例えば、Ti(O-isopropyl)<sub>4</sub>及び光学活性な酒石酸ジエチル(D又はL-体)等の酒石酸C1～6アルキルエステル類)の共存下に酸化する、いわゆるシャープレス酸化によって製造できる。

【0202】

この反応に使用される溶媒としては、本反応を阻害しない溶媒を広く使用できる。このような溶媒としては、例えば、アセトニトリル等の非プロトン性極性溶媒、ベンゼン、トルエン、キシレン、テトラリン、流動パラフィン、シクロヘキサン等の炭化水素系溶媒、塩化メチレン、クロロホルム、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素系溶媒、THF、ジオキサン、ジプロピルエーテル、ジエチルエーテル、ジグリム等のエーテル系溶媒、又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

#### 【0203】

クメンヒドロパーオキシド又はtert-ブチルヒドロペルオキシドは、化合物(6)に対して、通常0.1モル～2倍モル、好ましくは0.1モル～1.5倍モル、より好ましくは0.1倍～等モル使用すればよい。

#### 【0204】

Ti(O-isopropyl)<sub>4</sub>は、化合物(12)に対して、通常0.1～2倍モル、好ましくは0.1～1.5倍モル、より好ましくは0.1倍モル～等モル使用すればよい。

#### 【0205】

光学活性な酒石酸C1～6アルキルエステル類(D又はL-体)は、化合物(12)に対して、通常等モル～2倍モル、好ましくは等モル～1.5倍モル、より好ましくは等モル～1.3倍モル使用すればよい。

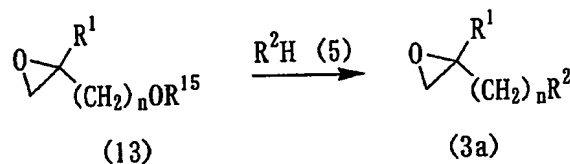
#### 【0206】

この反応の反応温度は、通常-50～30℃、好ましくは-20～20℃、より好ましくは-20～5℃である。また、反応時間は、通常1～48時間、好ましくは4～24時間、より好ましくは4～12時間である。

#### 【0207】

#### 【化19】

反応工程式-8



#### 【0208】

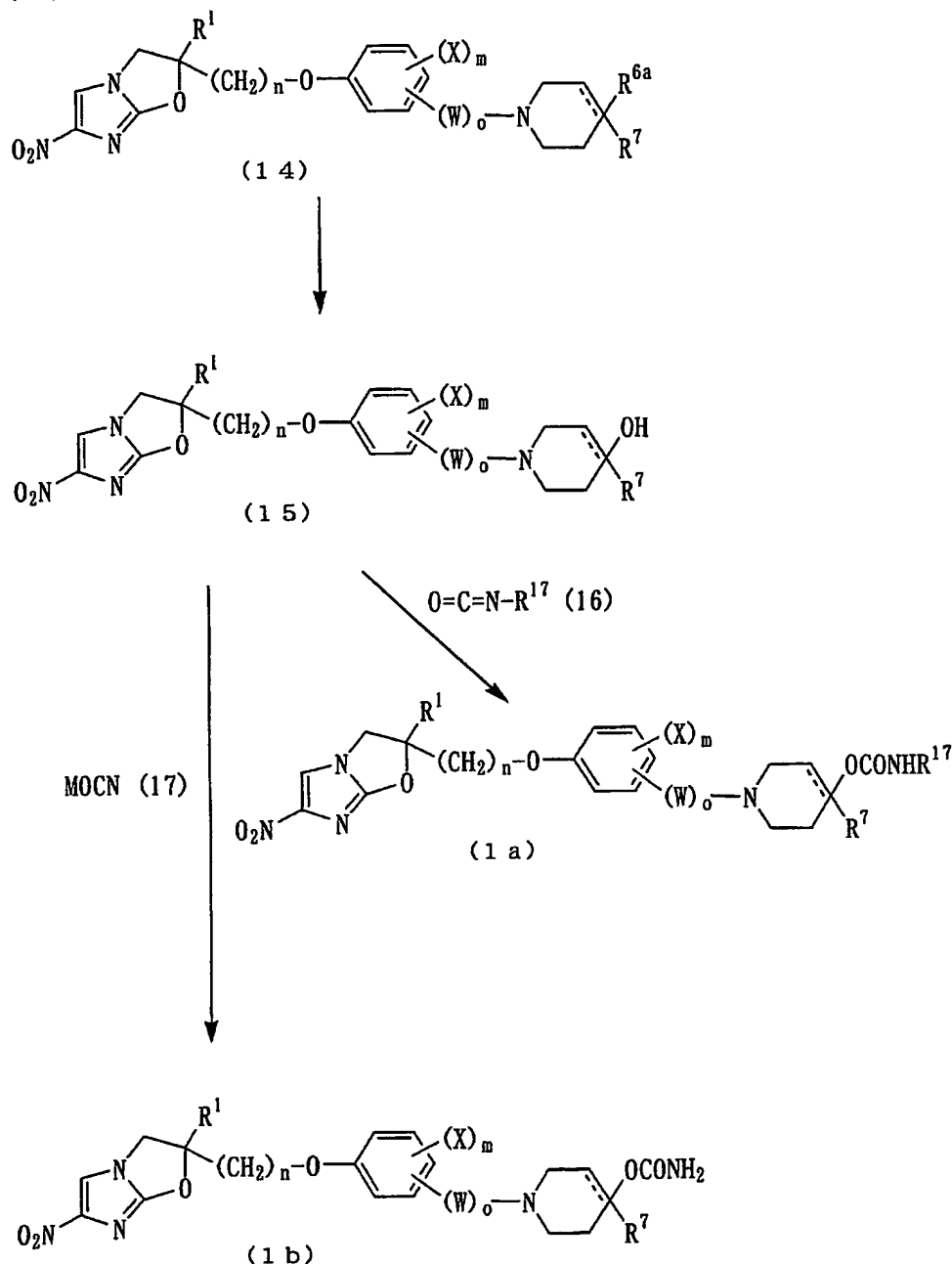
[式中、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>15</sup>及びnは前記に同じ。]

化合物(13)から化合物(3a)に導く反応は、例えば、反応工程式-3における化合物(6)から化合物(1)に導く反応と同様の反応条件下にて行われる。

#### 【0209】

## 【化 20】

反応工程式-9



## 【0210】

[式中、R<sup>1</sup>、X、n、m、W及びoは前記に同じ。R<sup>7</sup>は、水素原子、水酸基、C1～6アルコキシ基又はフェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子が置換していてもよい）を示す。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、ピペリジン環上に水酸基が置換するものとする。R<sup>6a</sup>はテトラヒドロピラニルオキシ基を示す。R<sup>17</sup>は、C1～6アルキル基又はフェニル基（該フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）を示す。Mはナトリウム、カリウム等のアルカリ金属を示す。]

化合物(14)を化合物(15)に導く反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、酸の存在

下で行われる。

【0211】

溶媒としては、反応に影響を与えないものをいずれも使用でき、例えば水、ジクロロメタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジオキサン、テトラヒドロフラン、エチレングリコールモノメチルエーテル、エチレングリコールジメチルエーテル等のエーテル類、蟻酸、酢酸等の脂肪酸、これらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0212】

酸としては、例えば塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸及び蟻酸、トリフルオロ酢酸、酢酸、ピリジニウム *p*-トルエンスルホン酸、*p*-トルエンスルホン酸等の芳香族スルホン酸等の有機酸を挙げることができる。酸の使用量は、特に限定されず広い範囲から適宜選択できるが、通常化合物(14) 1モルに対して0.1～10モル程度、好ましくは0.1～2モル程度とするのがよい。

【0213】

該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度にて好適に進行し、通常0.5～50時間程度にて反応は終了する。

【0214】

化合物(15)と化合物(16)又は(17)の反応は、塩基性化合物の存在下又は非存在下、好ましくは非存在下に適当な不活性溶媒又は無溶媒下で行われる。

【0215】

ここで用いられる塩基性化合物としては、例えばトリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、*N*-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、*N*-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基が挙げられる。

【0216】

用いられる溶媒としては、例えば、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水、*N,N*-ジメチルアセタミド、*N,N*-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

【0217】

化合物(16)又は(17)の使用量としては、各々、化合物(15)に対して通常等モル～5倍モル量程度、好ましくは等モル～3倍モル量程度とするのがよい。

【0218】

該反応は通常0～200℃程度、好ましくは室温～150℃程度付近の温度で、通常5分～30時間程度を要して行われる。

【0219】

該反応の反応系内には、三弗化硼素ジエチルエーテル錯体等の硼素化合物、塩化第一銅等のハロゲン化銅化合物等を添加してもよい。

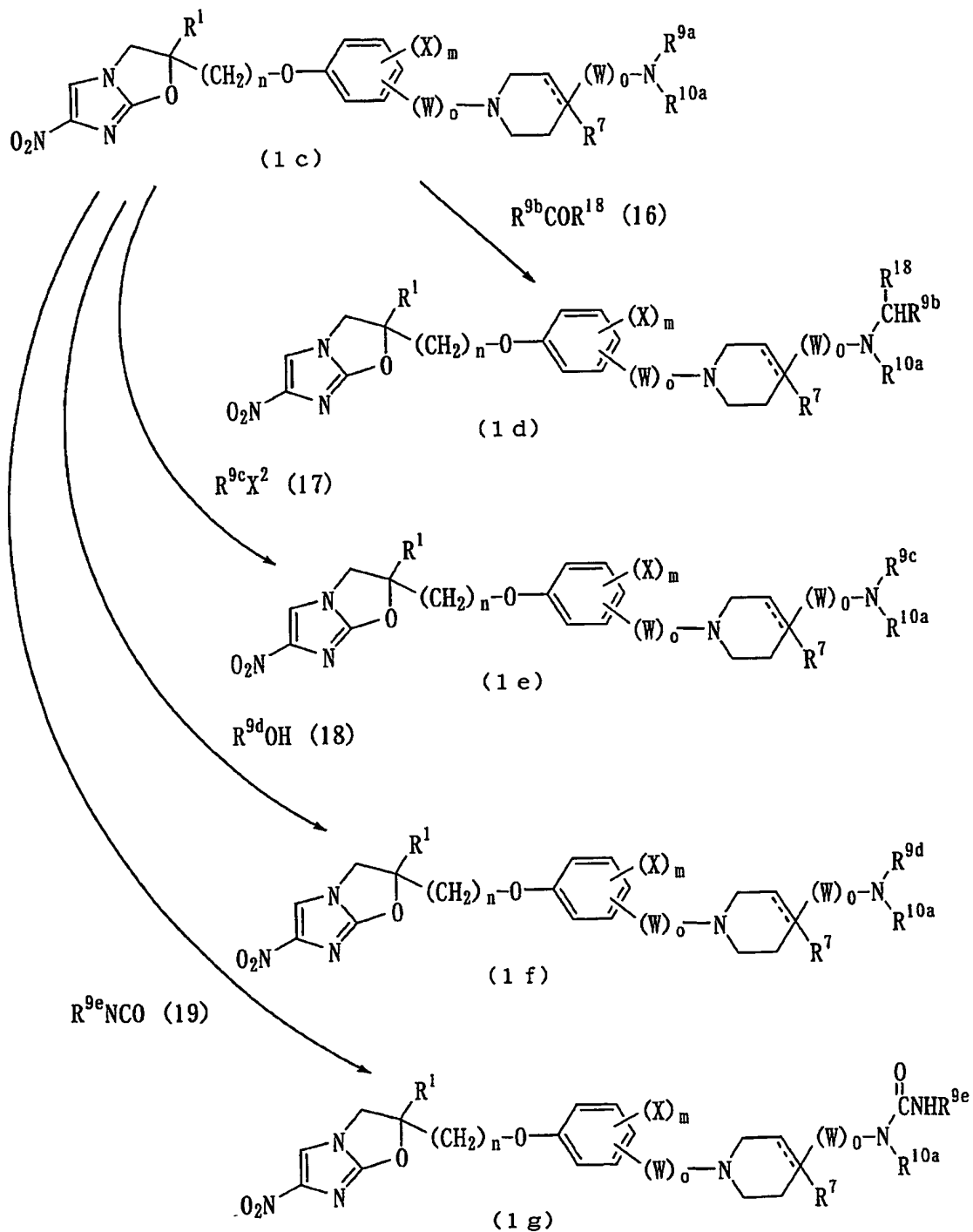
【0220】

化合物(15)と化合物(17)の反応では、反応系内にトリフルオロ酢酸等の有機酸を添加すると、反応は有利に進行する。

【0221】

【化21】

反応工程式-10



【0222】



[式中、 $R^1$ 、 $X$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $W$ 、 $R^7$ 、 $X^2$ 及び $o$ は前記に同じ。一般式(1c)～(1g)における二つの $W$ は同一であっても異なってもよい。

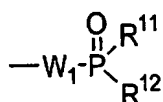
$R^{9a}$ は、水素原子を示す。

#### 【0223】

$R^{10a}$ は、水素原子；置換基として水酸基を有することのあるC1～6アルキル基；C1～6アルカノイル基；C1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC1～6アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基、置換基としてC1～6アルカノイル基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基（1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基が少なくとも1個置換していてもよい。））、C1～6アルキルスルホニル基、C3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C1～6アルキルチオ基；フェニルスルホニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）、水酸基置換C1～6アルキル基及び基

#### 【0224】

##### 【化22】



#### 【0225】

( $W_1$ はC1～6アルキレン基を示す。 $R^{11}$ 及び $R^{12}$ は、同一又は異なって、C1～6アルコキシ基を示す。)からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；フェニルC1～6アルキル基（フェニル環上には、置換基としてC1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルスルホニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基及びC1～4アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェノキシカルボニル基（フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルC2～6アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；C1～6アルコキシ置換C1～6アルキル基；C2～6アルケニル基；C1～6アルコキシ置換C2～6アルカノイル基；C3～8シクロアルキル置換C1～6アルキル基；フェノキシC1～6アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。）；ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい）；フェニルカルバモイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換

のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；ピリジル基；ピリジルC1～6アルキル基；イミダゾリルC1～6アルキル基；1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)；キノリル基；インドリル基；置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ基；インダゾリル基；ナフチル基；C3～8シクロアルキル基；置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換C1～6アルキル基；シアノ置換C1～6アルキル基；フリル置換C1～6アルキル基又はピペラジニル置換C1～6アルキル基(ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい。)を示す。

**【0226】**

R<sup>9b</sup>は、水素原子；置換基として水酸基を有することのあるC1～6アルキル基；フェニル基(フェニル環上には、置換基としてC1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)；フェニルC1～6アルキル基(フェニル環上には、置換基としてC1～4アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)；C1～6アルコキシ置換C1～6アルキル基；C3～8シクロアルキル置換C1～6アルキル基；C3～8シクロアルキル基；フェノキシC1～6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)；ピリジル基；ピリジルC1～6アルキル基；イミダゾリル基；イミダゾリルC1～6アルキル基；置換基としてC1～6アルキル基を有することのあるアミノ置換C1～6アルキル基；シアノ置換C1～6アルキル基；フリル置換C1～6アルキル基；フリル基；ピペラジニル基(ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい〕が置換していてもよい。)又はピペラジニル置換C1～6アルキル基(ピペラジン環上には、置換基として少なくとも1個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。〕が置換していてもよい。)を示す。

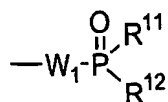
**【0227】**

R<sup>9c</sup>は、置換基として水酸基を有することのあるC1～6アルキル基；C1～6アルコキシカルボニル基；フェニルC1～6アルコキシカルボニル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい。)；フェニル基(該フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基、置換基としてC1～6アルカノイル基及びC1～6アルキル基からなる群より選ばれた基を有することのあるアミノ基、C1～6アルコキシカルボニル基、フェニル基、フェノキシ基、アミノスルホニル基、1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基(1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキソ基が少なくとも1個置換していてもよい)、C1～6アルキルスルホニル基、C3～8シクロアルキル基、ニトロ基、シアノ基、C1～6アルキルチオ基；フェニルスルホニル基(フェニル環上には、置換

基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)、水酸基置換 C 1～6 アルキル基及び基

【0228】

【化23】



【0229】

(W<sub>1</sub>は C 1～6 アルキレン基を示す。R<sup>11</sup>及び R<sup>12</sup>は、同一又は異なって、C 1～6 アルコキシ基を示す。)なる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい); フェニル C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、置換基として C 1～4 アルキレンジオキシ基、フェニル基、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。); フェニルスルホニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基及び C 1～4 アルキレンジオキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。); フェニル C 2～6 アルケニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい); C 1～6 アルコキシ置換 C 1～6 アルキル基; C 2～6 アルケニル基; C 3～8 シクロアルキル基置換 C 1～6 アルキル基; フェノキシ C 1～6 アルキル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい); ピリジル基; ピリジル C 1～6 アルキル基; イミダゾリル C 1～6 アルキル基; 1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリル基 (1, 2, 3, 4-テトラヒドロキノリン環上には、置換基としてオキシ基及び C 1～6 アルキル基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい); キノリル基; インドリル基; インダゾリル基; ナフチル基; C 3～8 シクロアルキル基; 置換基として C 1～6 アルキル基を有することのあるアミノ置換 C 1～6 アルキル基; シアノ置換 C 1～6 アルキル基; フリル置換 C 1～6 アルキル基又はピペラジニル置換 C 1～6 アルキル基 (ピペラジン環上には、置換基として少なくとも 1 個のフェニル基 [フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい] が置換していてもよい)を示す。

【0230】

R<sup>9d</sup>は、C 1～6 アルカノイル基; フェノキシカルボニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい); C 1～6 アルコキシ置換 C 2～6 アルカノイル基又はベンゾイル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。)を示す。

【0231】

R<sup>9e</sup>は、フェニル基 (フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい)を示す。

【0232】

$R^{18}$ は、水素原子又はC 1～6のアルキル基を示す。

【0233】

ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、基-(W)  $\text{oNR}^{9a}\text{R}^{10a}$ 、基-(W)  $\text{oN}(\text{CHR}^{18}\text{R}^{9b})\text{R}^{10a}$ 、基-(W)  $\text{oNR}^{9c}\text{R}^{10a}$ 、基-(W)  $\text{oNR}^{9d}\text{R}^{10a}$ 又は基-(W)  $\text{oN}(\text{CONHR}^{9e})\text{R}^{10a}$ が置換するものとする。

【0234】

一般式(1d)における基-N( $\text{R}^{10a}$ ) $\text{CHR}^{18}\text{R}^{9b}$ を構成する $\text{CHR}^{18}\text{R}^{9b}$ の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(1c)と化合物(16)との反応は、無溶媒又は適当な溶媒中、還元剤の存在下に行われる。

【0235】

化合物(16)の使用量は、化合物(1c)に対して通常少なくとも等モル量、好ましくは等モル～大過剰量とするのがよい。

【0236】

該反応において使用される溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、アセトニトリル、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸等の脂肪酸、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類又はこれらの混合溶媒等を例示できる。

【0237】

還元剤としては、例えば、蟻酸、蟻酸ナトリウム等の蟻酸アルカリ金属塩、水素化硼素ナトリウム、水素化シアノ硼素ナトリウム、水素化トリアセチルオキシ硼素ナトリウム、水素化アルミニウムリチウム等の水素化還元剤又はこれらの水素化還元剤の混合物、パラジウム-黒、パラジウム-炭素、酸化白金、白金黒、ラネーニッケル等の接触水素還元剤等を例示できる。

【0238】

還元剤として蟻酸及び蟻酸アルカリ金属塩を使用する場合、反応温度は通常室温～200℃程度、好ましくは50～150℃程度付近が適当であり、反応は10分～10時間程度にて終了する。蟻酸の使用量は化合物(1c)に対して大過剰量使用するのがよい。

【0239】

また水素化還元剤を使用する場合、反応温度は通常-80～100℃程度、好ましくは-80～70℃程度が適当であり、30分～100時間程度で反応は終了する。水素化還元剤の使用量は、化合物(1c)に対して通常等モル～20倍モル量程度、好ましくは等モル～6倍モル程度とするのがよい。特に水素化還元剤として水素化アルミニウムリチウムを使用する場合、溶媒としてジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類を使用するのが好ましい。該反応の反応系内には、トリメチルアミン、トリエチルアミン、N-エチルジイソプロピルアミン等のアミン類、モレキュラーシーヴス 3A(MS-3A)、モレキュラーシーヴス 4A(MS-4A)等のモレキュラーシーヴス等を添加してもよい。

【0240】

更に接触水素還元剤を用いる場合は、通常常圧～20気圧程度、好ましくは常圧～10気圧程度の水素雰囲気中で、又は蟻酸、蟻酸アンモニウム、シクロヘキセン、放水ヒドラジン等の水素供与剤の存在下で、通常-30～100℃程度、好ましくは0～60℃程度の温度で反応を行なうのがよく、通常1～12時間程度で反応は終了する。接触水素還元剤の使用量としては、化合物(1c)に対して通常0.1～40重量%、好ましくは1～20重量%程度とするのがよい。

【0241】

化合物(1c)と化合物(17)との反応は、一般に適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下にて行われる。

【0242】

用いられる不活性溶媒としては、例えば、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、ジクロロメタン、ジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、メタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、tert-ブタノール、エチレングリコール等の低級アルコール類、酢酸等の脂肪酸、酢酸エチル、酢酸メチル等のエステル類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、アセトニトリル、ピリジン、ジメチルスルホキシド、N、N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0243】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、炭酸セシウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化ナトリウム、水素化カリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート、ナトリウムn-ブトキシド等の金属アルコラート類、ピリジン、イミダゾール、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ジメチルアニリン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABCO)等の有機塩基又はこれらの混合物を挙げることができる。

【0244】

塩基性化合物は、化合物(1c)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル~10倍モル量使用するのがよい。

【0245】

化合物(17)は、化合物(1c)に対して少なくとも等モル量、好ましくは、等モル~10倍モル量使用するのがよい。

【0246】

該反応は、通常0~200℃、好ましくは、0~150℃程度にて行われ、一般に5分~80時間程度にて反応は終了する。

【0247】

該反応系内には沃化ナトリウム、沃化カリウム等のアルカリ金属ハロゲン化合物等を添加してもよいし、相間移動触媒を添加してもよい。

【0248】

ここで相間移動触媒としては、例えば、テトラブチルアンモニウムクロリド、テトラブチルアンモニウムプロミド、テトラブチルアンモニウムフルオリド、テトラブチルアンモニウムアイオダイド、テトラブチルアンモニウムヒドロキシド、亜硫酸水素テトラブチルアンモニウム、トリブチルメチルアンモニウムクロリド、トリブチルベンジルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムクロリド、テトラペンチルアンモニウムプロミド、テトラヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクチルアンモニウムクロリド、メチルトリヘキシルアンモニウムクロリド、ベンジルジメチルオクタデカニルアンモニウムクロリド、メチルトリデカニルアンモニウムクロリド、ベンジルトリプロピルアンモニウムクロリド、ベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、フェニルトリエチルアンモニウムクロリド、テトラエチルアンモニウムクロリド、テトラメチルアンモニウムクロリド等の炭素数1~18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基、フェニル低級アルキル基及びフェニル基からなる群より選ばれた基が置換した4級アンモニウム塩、テトラブチルホスホニウムクロリド等の炭素数1~18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したホスホニウム塩、1-ドデカニルピリジニウムクロリド等の炭素数1~18の直鎖又は分枝鎖状のアルキル基が置換したピリジニウム塩等を例示できる。

## 【0249】

相間移動触媒の使用量は、化合物(1c)に対して、通常0.1倍モル～等モル量、好ましくは、0.1～0.5倍モル量使用するのがよい。

## 【0250】

化合物(1c)と化合物(18)との反応は、化合物(1c)と化合物(18)のカルボン酸とを通常のアミド結合生成反応にて反応させる方法である。

## 【0251】

該アミド結合生成反応には、公知のアミド結合生成反応の条件を広く適用することができる。例えば(イ)混合酸無水物法、即ちカルボン酸(18)にアルキルハロカルボン酸を反応させて混合酸無水物とし、これにアミン(1c)を反応させる方法、(ロ)活性エステル法、即ちカルボン酸(18)を、p-ニトロフェニルエステル、N-ヒドロキシコハク酸イミドエステル、1-ヒドロキシベンゾトリアゾールエステル等の活性エステル、又はベンズオキサゾリン-2-チオンとの活性アミドとし、これにアミン(1c)を反応させる方法、(ハ)カルボジイミド法、即ちカルボン酸(18)にアミン(1c)をジシクロヘキシルカルボジイミド、1-(3-ジメチルアミノプロピル)-3-エチルカルボジイミド(WSC)、カルボニルジイミダゾール等の活性化剤の存在下に縮合反応させる方法、(ニ)その他の方法、例えばカルボン酸(18)を無水酢酸等の脱水剤によりカルボン酸無水物とし、これにアミン(1c)を反応させる方法、カルボン酸(18)と低級アルコールとのエステルにアミン(1c)を高圧高温下に反応させる方法、カルボン酸(18)の酸ハロゲン化物、即ちカルボン酸ハライドにアミン(1c)を反応させる方法等を挙げることができる。

## 【0252】

上記混合無水物法(イ)において用いられる混合酸無水物は、通常のリッテンバウマン反応により得られ、これを通常単離することなくアミン(1c)と反応させることにより一般式(1f)の本発明化合物が製造される。

## 【0253】

上記リッテンバウマン反応は塩基性化合物の存在下に行われる。

## 【0254】

用いられる塩基性化合物としては、リッテンバウマン反応に慣用の化合物、例えば、トリエチルアミン、トリメチルアミン、ピリジン、ジメチルアニリン、N-エチルジイソプロピルアミン、ジメチルアミノピリジン、N-メチルモルホリン、1,5-ジアザビシクロ[4.3.0]ノネン-5(DBN)、1,8-ジアザビシクロ[5.4.0]ウンデセン-7(DBU)、1,4-ジアザビシクロ[2.2.2]オクタン(DABC O)等の有機塩基、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム等の金属水酸化物、水素化カリウム、水素化ナトリウム、カリウム、ナトリウム、ナトリウムアミド、ナトリウムメチラート、ナトリウムエチラート等の金属アルコラート類等の無機塩基が挙げられる。

## 【0255】

該反応は、通常-20～100℃程度、好ましくは0～50℃程度において行われ、反応時間は5分～10時間程度、好ましくは5分～2時間程度である。

## 【0256】

得られた混合酸無水物とアミン(1c)との反応は、通常-20～150℃程度、好ましくは10～50℃程度にて行われ、反応時間は5分～10時間程度、好ましくは5分～5時間程度である。混合酸無水物法は一般に溶媒中で行われる。

## 【0257】

用いられる溶媒としては混合酸無水物法に慣用されている溶媒がいずれも使用可能であり、具体的にはクロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン、ジメトキシエタン等のエーテル類、

酢酸メチル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル等のエステル類、N、N-ジメチルアセタミド、N、N-ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、ヘキサメチル燐酸トリアミド等の非プロトン性極性溶媒又はこれらの混合溶媒等が挙げられる。

#### 【0258】

混合酸無水物法において使用されるアルキルハロカルボン酸としては、例えば、クロロ蟻酸メチル、ブromo蟻酸メチル、クロロ蟻酸エチル、ブromo蟻酸エチル、クロロ蟻酸イソブチル等が挙げられる。該法におけるカルボン酸(18)とアルキルハロカルボン酸とアミン(1c)の使用割合は通常等モルずつとするのがよいが、アミン(1c)に対してアルキルハロカルボン酸及びカルボン酸(18)はそれぞれ等モル～1.5倍モル量程度の範囲内で使用することができる。

#### 【0259】

また前記活性化剤の存在下に縮合反応させる方法(ハ)においては、適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下又は非存在下に行われる。

#### 【0260】

ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、下記その他の方法(ニ)のカルボン酸ハライドにアミン(1c)を反応させる方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

#### 【0261】

活性化剤の使用量は、化合物(1c)に対して少なくとも等モル量、好ましくは等モル～5倍モル量使用するのがよい。活性化剤としてWSCを使用する場合は、反応系内に1-ヒドロキシベンゾトリアゾールを添加すると反応は有利に進行する。

#### 【0262】

該反応は、通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～90時間程度で反応は完結する。

#### 【0263】

また前記その他の方法(ニ)の中で、カルボン酸ハライドにアミン(1c)を反応させる方法を採用する場合、該反応は塩基性化合物の存在下に、適当な溶媒中で行われる。

#### 【0264】

用いられる塩基性化合物としては、公知のものを広く使用でき、例えば、上記ショッテン-バウマン反応に用いられる塩基性化合物をいずれも使用することができる。

#### 【0265】

用いられる溶媒としては、例えば、上記混合酸無水物法に用いられる溶媒の他に、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ブタノール、3-メトキシ-1-ブタノール、エチルセロソルブ、メチルセロソルブ等のアルコール類、アセトニトリル、ピリジン、アセトン、水等を挙げることができる。

#### 【0266】

アミン(1c)とカルボン酸ハライドとの使用割合としては、特に限定がなく広い範囲内で適宜選択すればよいが、通常前者に対して後者を少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル～5倍モル量程度用いるのがよい。

#### 【0267】

該反応は通常-20～180℃程度、好ましくは0～150℃程度にて行われ、一般に5分～50時間程度で反応は完結する。

#### 【0268】

更に上記アミド結合生成反応は、カルボン酸(18)とアミン(1c)とを、ジフェニルホスフィニッククロリド、フェニル-N-フェニルホスホラミドクロリデート、ジエチルクロロホスフェート、シアノリン酸ジエチル、ジフェニルリン酸アジド、ビス(2-オキソ-3-オキサゾリジニル)ホスフィニッククロリド等の燐化合物の縮合剤の存在下に反応させる方法によっても実施することができる。

#### 【0269】

該反応は、上記カルボン酸ハライドにアミン(1c)を反応させる方法で用いられる溶

媒及び塩基性化合物の存在下に、通常 $-20 \sim 150^{\circ}\text{C}$ 程度、好ましくは $0 \sim 100^{\circ}\text{C}$ 程度付近にて行われ、一般に5分 $\sim$ 30時間程度にて反応は終了する。縮合剤及びカルボン酸(18)は、アミン(1c)に対してそれぞれ少なくとも等モル量程度、好ましくは等モル $\sim$ 2倍モル量程度使用するのがよい。

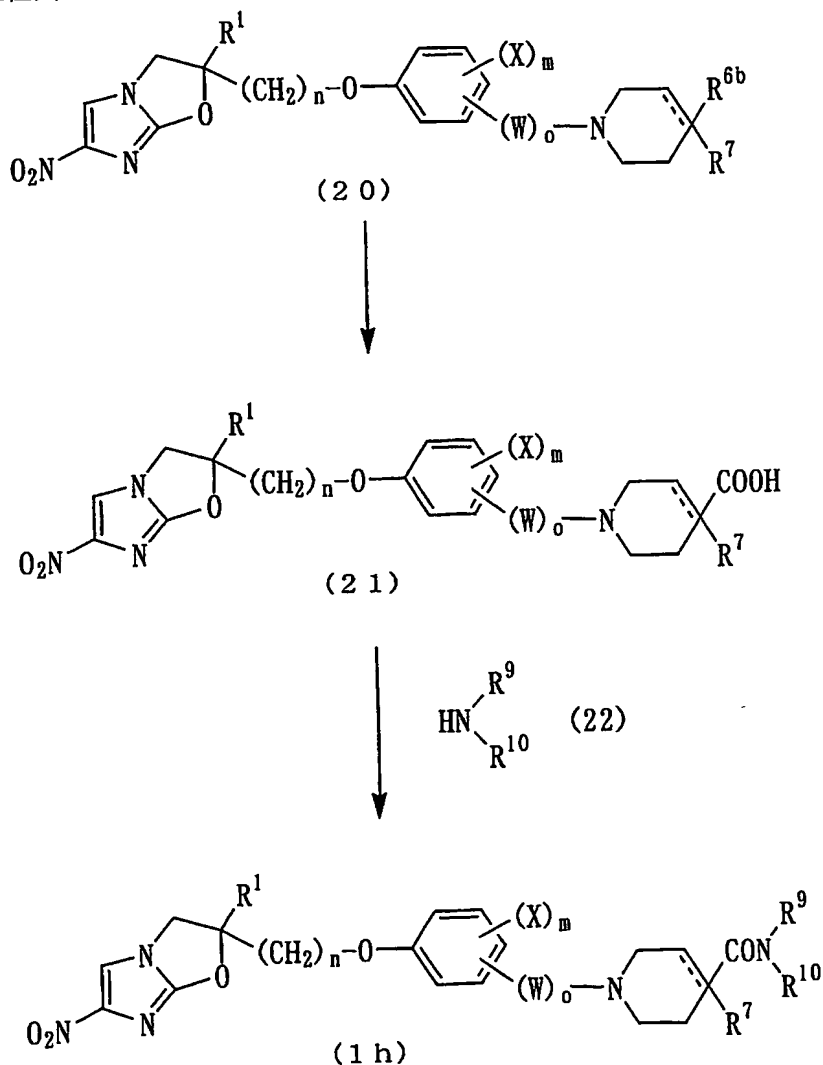
【0270】

化合物(1c)と化合物(19)との反応は、前記反応工程式-9における化合物(15)と化合物(16)又は(17)との反応と同様の反応条件下に行うことができる。

【0271】

【化24】

反応工程式-11



【0272】

[式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{X}$ 、 $n$ 、 $m$ 、 $\text{W}$ 、 $\text{R}^7$ 、 $\text{R}^9$ 、 $\text{R}^{10}$ 及び $o$ は前記に同じ。 $\text{R}^{6b}$ は、C1 $\sim$ 6アルコキシカルボニル基を示す。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、基 $\text{R}^{6b}$ 、 $\text{COOH}$ 基又は基 $-\text{CONR}^9\text{R}^{10}$ が置換するものとする。]

化合物(21)は、化合物(20)を加水分解することにより製造される。

【0273】

該加水分解反応は、適当な溶媒中又は無溶媒下、酸又は塩基性化合物の存在下に行われ



る。

【0274】

用いられる溶媒としては、例えば、水、メタノール、エタノール、イソプロパノール、tert-ブタノール等の低級アルコール類、アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン、モノグライム、ジグライム等のエーテル類、酢酸、蟻酸等の脂肪酸類、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類、クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、ジメチルスルホキシド、N, N-ジメチルホルムアミド、ヘキサメチル燐酸トリアミド又はこれらの混合溶媒等を挙げることができる。

【0275】

酸としては、例えば、塩酸、硫酸、臭化水素酸等の鉱酸、蟻酸、酢酸、トリフルオロ酢酸、P-トルエンスルホン酸等のスルホン酸等の有機酸を挙げることができる。

【0276】

塩基性化合物としては、例えば、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム等の炭酸塩、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化カルシウム、水酸化リチウム等の金属水酸化物等を挙げることができる。

【0277】

酸又は塩基性化合物は、化合物(20)に対して少なくとも等モル、好ましくは等モル～10倍モル使用するが、反応溶媒として大過剰に用いてもよい。

【0278】

該反応は、通常0～200℃程度、好ましくは0～150℃程度にて好適に進行し、一般に10分～30時間程度で終了する。

【0279】

上記加水分解処理後、反応を完結させるために適当な溶媒中、塩基性化合物の存在下に通常0～100℃、好ましくは室温～70℃付近にて、1分～30分程度反応させてもよい。ここで使用される溶媒及び塩基性化合物としては、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(18)の反応のうち、方法(二)のカルボン酸ハライドにアミン(1c)を反応させる方法で用いられる溶媒及び塩基性化合物をいずれも使用することができる。

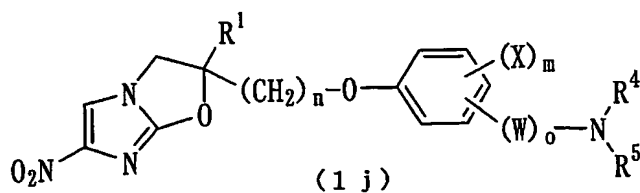
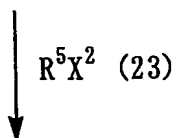
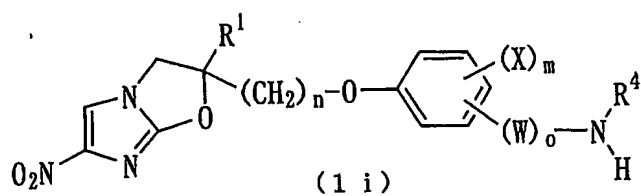
【0280】

化合物(21)と化合物(22)との反応は、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(18)との反応と同様の反応条件下に行われる。ただし、使用量は、前記反応式-10がアミン(1c)に対してカルボン酸(18)の使用量を換算していたが、該反応では、カルボン酸(18)に対してアミン(22)の使用量を換算する。

【0281】

## 【化 25】

## 反応工程式-12



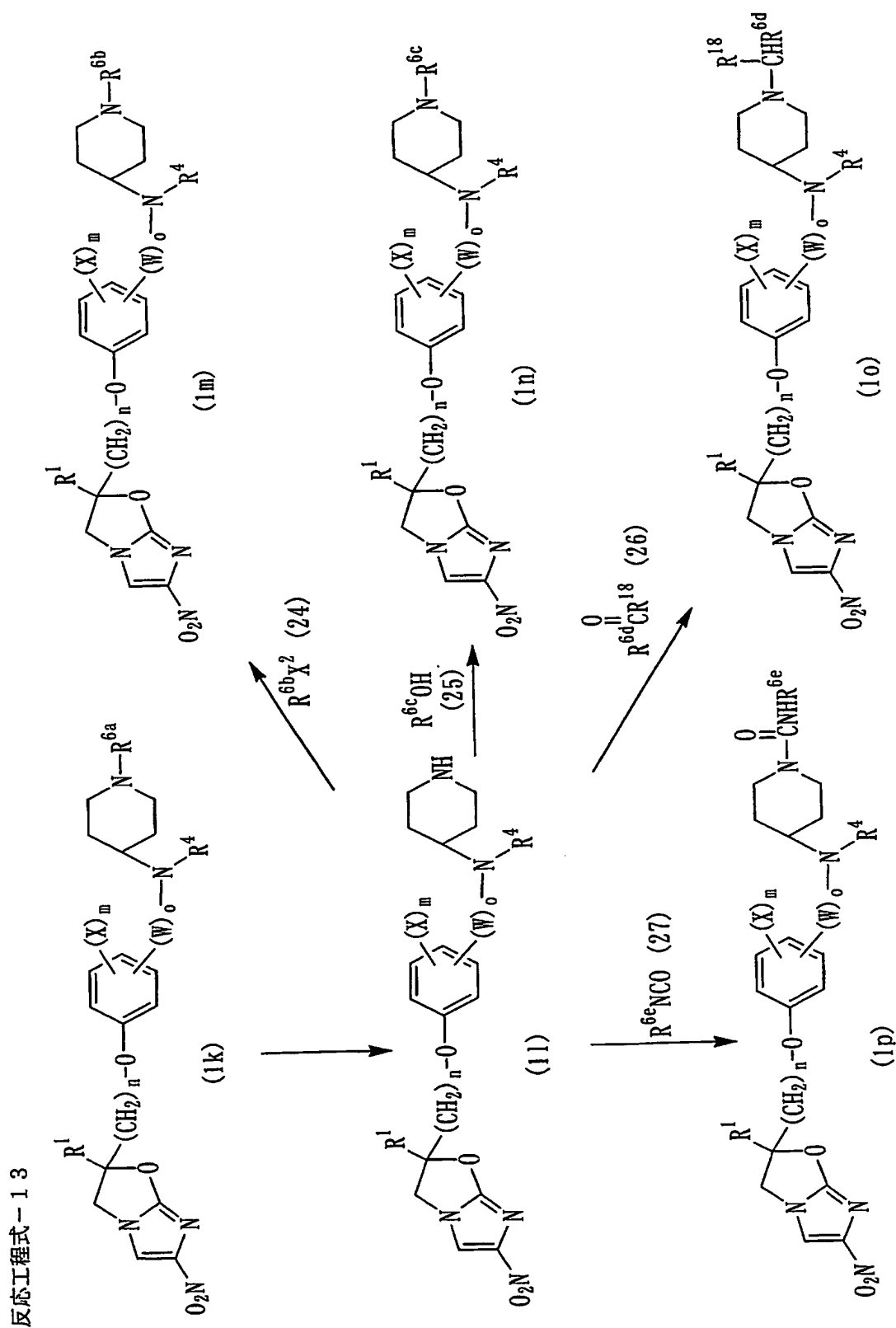
## 【0282】

[式中、 $R^1$ 、 $n$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $W$ 、 $o$ 、 $X^2$ 、 $R^4$ 及び $R^5$ は前記に同じ。]

化合物(1 i)と化合物(23)との反応は、前記反応式-10における化合物(1 c)と化合物(17)との反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0283】

【化26】



【0284】

[式中、 $R^1$ 、 $n$ 、 $R^{18}$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $W$ 、 $o$ 、 $R^4$ 及び $X^2$ は前記に同じ。

## 【0285】

R<sup>6a</sup>は、C 1～6 アルコキシカルボニル基を示す。

## 【0286】

R<sup>6b</sup>は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；フェニル C 1～6 アルコキシカルボニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；ベンゾフリル C 1～6 アルキル基（ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい）；フェノキシ C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；チアゾリル C 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）；フェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；C 1～6 アルコキシカルボニル基；又はフェニル C 2～6 アルケニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。

## 【0287】

R<sup>6c</sup>は、ベンゾイル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。

## 【0288】

R<sup>6d</sup>は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）；ベンゾフリル C 1～6 アルキル基（ベンゾフラン環上には、置換基として少なくとも 1 個のハロゲン原子が置換していてもよい）；ベンゾフリル基（該ベンゾフラン環上には、置換基としてハロゲン原子を少なくとも 1 個置換していてもよい。）；フェノキシ C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい。）；チアゾリル C 1～6 アルキル基（チアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい〕が置換していてもよい）；チアゾリル基（チアゾール環上には、少なくとも 1 個のフェニル基〔フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基を少なくとも 1 種置換していてもよい。〕が置換していてもよい。）又はフェニル C 1～6 アルキル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。

## 【0289】

R<sup>6e</sup>は、フェニル基（フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルキル基及びハロゲン置換又は未置換の C 1～6 アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも 1 種が置換していてもよい）を示す。

## 【0290】

一般式(1o)における基-CHR<sup>18</sup>R<sup>6d</sup>の総炭素数は6を超えないものとする。]

化合物(1k)を化合物(11)に導く反応は、前記反応式-11における化合物(20)を化合物(21)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0291】

化合物(11)と化合物(24)との反応は、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(17)との反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0292】

化合物(11)と化合物(25)との反応は、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(18)との反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0293】

化合物(11)と化合物(26)との反応は、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(16)との反応と同様の反応条件下に行われる。

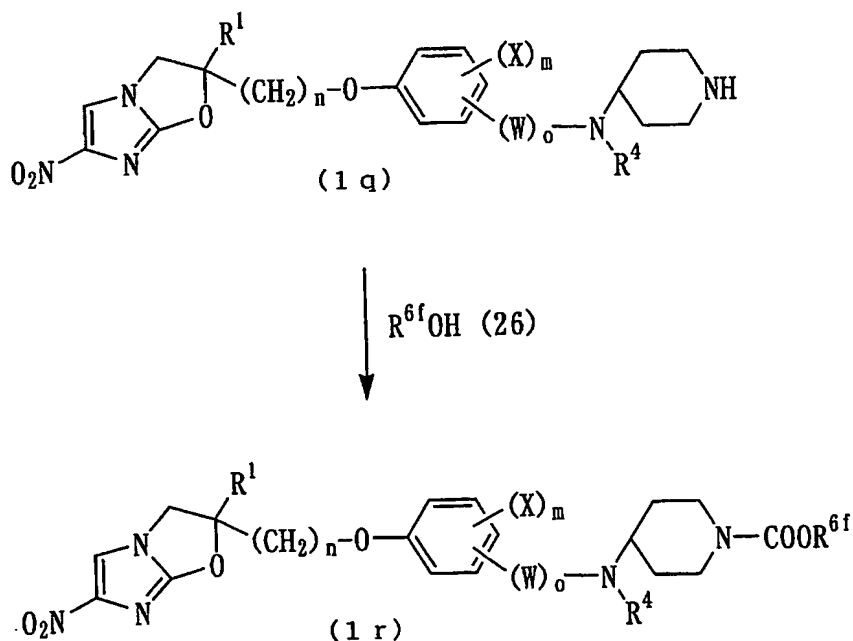
## 【0294】

化合物(11)と化合物(27)との反応は、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(19)との反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0295】

## 【化27】

反応工程式-14



## 【0296】

[式中、R<sup>1</sup>、n、X、m、W、o及びR<sup>4</sup>は前記に同じ。R<sup>6f</sup>は、C1~6アルキル基又はフェニルC1~6アルキル基(フェニル環上には、ハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1~6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1~6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。]

化合物(1q)と化合物(26)との反応は、適当な溶媒中、縮合剤の存在下に行われる。

## 【0297】

ここで使用される溶媒としては、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(18)との反応のうち、方法(二)のカルボン酸ハライドにアミン(1c)を反応させる

方法で用いられる溶媒をいずれも使用することができる。

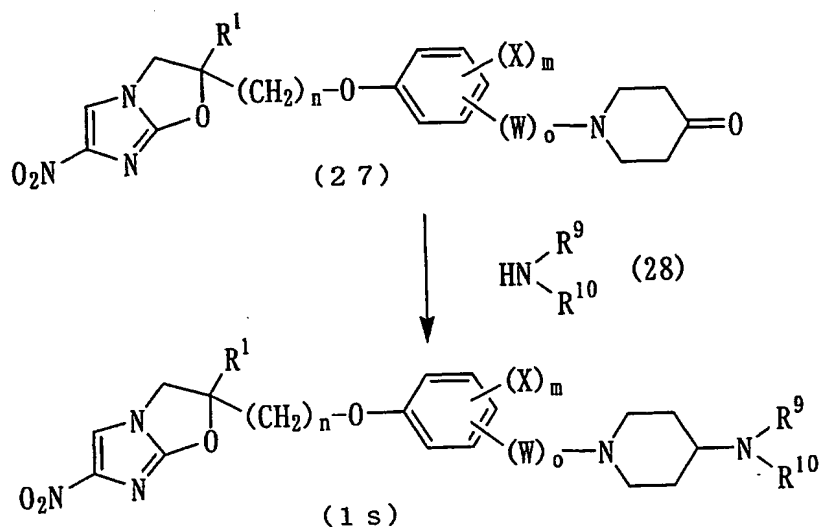
【0298】

縮合剤としては、例えば、N, N' -カルボニルジイミダゾール等を挙げることができる。化合物(26)及び縮合剤の使用量は、化合物(1q) 1モルに対して少なくとも1モル、好ましくは1~2モル程度使用するのがよい。該反応は、通常0~150℃、好ましくは0~100℃付近にて1~30時間程度にて終了する。

【0299】

【化28】

反応工程式-15



【0300】

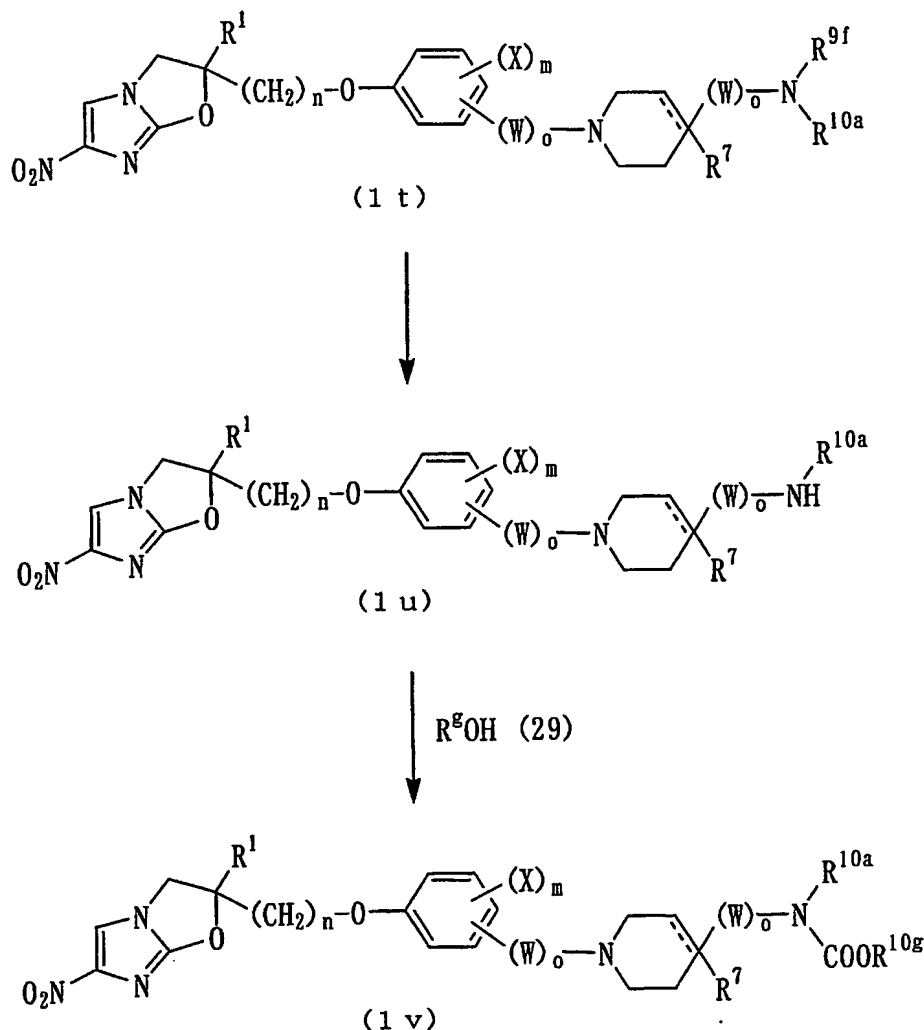
[式中、R<sup>1</sup>、n、X、m、W、o、R<sup>9</sup>及びR<sup>10</sup>は前記に同じ。]

化合物(27)と化合物(26)との反応は、前記反応式-10における化合物(1c)と化合物(16)との反応と同様の反応条件下に行われる。

【0301】

## 【化 29】

反応工程式-16



## 【0302】

[式中、 $R^1$ 、 $n$ 、 $X$ 、 $m$ 、 $W$ 、 $o$ 及び $R^{10a}$ は前記に同じ。一般式(1t)～(1v)における二つの $W$ は同一であっても異なってもよい。 $R^{9f}$ は、C1～6アルコキシカルボニル基を示す。ピペリジン環上の点線は二重結合であってもよいことを示す。点線が二重結合のときは、基- $(W)_oNR^{9f}R^{10a}$ 、基- $(W)_oNHR^{10a}$ 又は基- $(W)_oNR^{10a}(COOR^{10g})$ が置換するものとする。 $R^g$ は、C1～6アルキル基又はフェニルC1～6アルキル基(フェニル環上には、置換基としてハロゲン原子、ハロゲン置換又は未置換のC1～6アルキル基及びハロゲン置換又は未置換のC1～6アルコキシ基からなる群より選ばれた基の少なくとも1種が置換していてもよい)を示す。]

化合物(1t)を化合物(1u)に導く反応は、前記反応式-11における化合物(20)を化合物(21)に導く反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0303】

化合物(1u)と化合物(29)との反応は、前記反応式-14における化合物(1q)と化合物(26)との反応と同様の反応条件下に行われる。

## 【0304】

反応工程式-9の出発原料化合物(14)及び反応工程式-11の出発原料化合物(20)は、新規化合物である。これらの化合物は、例えば、対応する出発原料を用い、前記反応工程式-1～-3に示す方法に従うことにより容易に製造することができる。

#### 【0305】

本発明の一般式(1)で表される化合物(最終化合物)及び上記各反応工程式において得られる中間体は、立体異性体及び光学異性体を包含する。

#### 【0306】

上記に示す各反応工程式で得られる各々の目的化合物は、反応混合物を、例えば、冷却した後、濾過、濃縮、抽出等の単離操作によって粗反応生成物を分離し、カラムクロマトグラフィー、再結晶等の通常の精製操作によって、反応混合物から単離精製することができる。

#### 【0307】

本発明化合物は、医薬的に許容される塩を包含する。斯かる塩としては、例えば塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫酸塩、リン酸塩等の無機酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、酢酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、乳酸塩等の有機酸塩等が挙げられる。

#### 【0308】

次に、本発明化合物を有効成分として含有する医療製剤について説明する。

#### 【0309】

上記医療製剤は、本発明化合物を通常の医療製剤の形態に製剤したものであって、通常使用される充填剤、増量剤、結合剤、付湿剤、崩壊剤、表面活性剤、滑沢剤等の希釈剤あるいは賦形剤を用いて調製される。

#### 【0310】

このような医療製剤としては、治療目的に応じて種々の形態の中から選択でき、その代表的なものとして錠剤、丸剤、散剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤、カプセル剤、坐剤、注射剤(液剤、懸濁剤等)等が挙げられる。

#### 【0311】

錠剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、乳糖、白糖、塩化ナトリウム、ブドウ糖、尿素、デンプン、炭酸カルシウム、カオリン、結晶セルロース等の賦形剤、水、エタノール、プロパノール、単シロップ、ブドウ糖液、デンプン液、ゼラチン溶液、カルボキシメチルセルロース、セラック、メチルセルロース、リン酸カリウム、ポリビニルピロリドン等の結合剤、乾燥デンプン、アルギン酸ナトリウム、寒天末、ラミナラン末、炭酸水素ナトリウム、炭酸カルシウム、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類、ラウリル硫酸ナトリウム、ステアリン酸モノグリセリド、デンプン、乳糖等の崩壊剤、白糖、ステアリン、カカオバター、水素添加油等の崩壊抑制剤、第4級アンモニウム塩基、ラウリル硫酸ナトリウム等の吸収促進剤、グリセリン、デンプン等の保湿剤、デンプン、乳糖、カオリン、ベントナイト、コロイド状ケイ酸等の吸着剤、精製タルク、ステアリン酸塩、ホウ酸末、ポリエチレングリコール等の滑沢剤等が挙げられる。

#### 【0312】

更に、錠剤は、必要に応じて通常の錠皮を施した錠剤、例えば、糖衣剤、ゼラチン被包錠、腸溶被錠、フィルムコーティング錠あるいは二重錠、多層錠とすることができる。

#### 【0313】

丸剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ブドウ糖、乳糖、デンプン、カカオ脂、硬化植物油、カオリン、タルク等の賦形剤、アラビアゴム末、トラガント末、ゼラチン、エタノール等の結合剤、ラミナラン、寒天等の崩壊剤等が挙げられる。

#### 【0314】

坐剤の形態に成形する際に用いられる担体としては、公知のものを広く使用でき、例えば、ポリエチレングリコール、カカオ脂、高級アルコール、高級アルコールのエステル類



、ゼラチン、半合成グリセライド等が挙げられる。

【0315】

注射剤として調製される場合は、液剤、乳剤及び懸濁剤は殺菌され、かつ血液と等張であるのが好ましい。これらの液剤、乳剤及び懸濁剤の形態に成形する際に用いられる希釈剤としては、公知のものを広く用いられているものを使用することができ、例えば、水、エタノール、プロピレングリコール、エトキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシ化イソステアリルアルコール、ポリオキシエチレンソルベタン脂肪酸エステル類等が挙げられる。なお、この場合、等張性の溶液を調製するのに十分な量の食塩、ブドウ糖あるいはグリセリンを医薬製剤中に含有させてもよく、また通常の溶解補助剤、緩衝剤、無痛化剤等を、更に必要に応じて着色剤、保存剤、香料、風味剤、甘味剤等や他の医薬品を含有させてもよい。

【0316】

医療製剤中に含有される本発明化合物の量は、特に限定されず広い範囲内から適宜選択することができるが、通常、医療製剤中に本発明化合物を1～70重量%含有させるのが好ましい。

【0317】

本発明に係る医療製剤の投与方法としては特に制限はなく、各種製剤形態、患者の年齢、性別、疾患の状態、その他の条件に応じた方法で投与される。例えば、錠剤、丸剤、液剤、懸濁剤、乳剤、顆粒剤及びカプセル剤の場合には経口投与される。また、注射剤の場合には、単独であるいはブドウ糖、アミノ酸等の通常の補液と混合して静脈内に投与したり、更には必要に応じて単独で筋肉内、皮内、皮下もしくは腹腔内に投与することができる。坐剤の場合には、直腸内に投与される。

【0318】

上記医療製剤の投与量は、用法、患者の年齢、性別、疾患の程度、その他の条件に応じて適宜選択すればよく、通常、1日あたり体重1kgに対して0.01～100mg、好ましくは0.1～50mgを1回～数回に分けて投与される。

【0319】

上記投与量は、種々の条件で変動するので、上記範囲より少ない投与量で十分な場合もあるし、また上記範囲を超えた投与量が必要な場合もある。

【発明の効果】

【0320】

本発明化合物は、特に抗酸菌等の結核菌（結核菌属、非定型抗酸菌属）に対して特異的効力を有している。本発明化合物は、多剤耐性結核菌に対して優れた効果を有している。本発明化合物は、嫌気性菌に対して抗菌作用を有している。

【0321】

本発明化合物は、インビトロで上記活性を示すばかりでなく、経口投与においても上記活性を発現する。

【0322】

本発明化合物は、グラム陽性菌、グラム陰性菌等の一般細菌に対して幅広いスペクトラムを有している公知の抗菌剤に見られるような下痢症を誘発することなく、既存薬と比べ副作用も少ないことから、長期間の服薬が可能な医療製剤になり得る。

【0323】

本発明化合物は、抗酸菌感染症の主な感染臓器である肺組織に対し、良好に分布し得、薬効の持続時間が長い、安全性に優れている等の特性を有することから、高い治療効果が期待できる。

【0324】

本発明化合物は、ヒト由来マクロファージ内寄生結核菌等の細胞内寄生菌に対しても既存の抗結核剤と比較して、強い殺菌力を示すことから、結核症の再燃率の低減、ひいては短期化学療法を可能にし、HIVと結核の混合感染が深刻な問題となっていることから行われている予防的投与薬の主軸としての使用も期待できるものである。

## 【発明を実施するための最良の形態】

## 【0325】

以下に、製剤例、試験例、参考例及び実施例を挙げる。

## 【0326】

## 製剤例 1

本発明化合物 100 g、アビセル（商標名、旭化成（株）製）40 g、コーンスターチ 30 g 及びステアリン酸マグネシウム 2 g を混合研磨後、糖衣 R 10 mm のキネで打錠した。

## 【0327】

得られた錠剤を TC-5（商標名、信越化学工業（株）製、ヒドロキシプロピルメチルセルロース）10 g、ポリエチレングルコール 6000 3 g、ひまし油 40 g 及び適量のエタノールからなるフィルムコーティング剤を用いて皮膜を行い、上記組成のフィルムコーティング錠を製造した。

## 【0328】

## 参考例 1

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジンの製造

4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン (2.52 g、11.22 ミリモル)、2- (4-ブromoフェノキシ) テトラヒドロピラン (2.89 g、11.22 ミリモル)、酢酸パラジウム (50 mg、0.22 ミリモル)、(S) - (1) -2, 2-ビス (ジフェニルホスフィノ) -1, 1'-ビナフチル (BINAP) (212 mg、0.34 ミリモル) 及び tert-ブトキシナトリウム (1.51 g、15.71 ミリモル) を窒素雰囲気下トルエン (30 ml) 中にて 3 時間加熱還流した。反応液に酢酸エチル及び水を加え、攪拌して沈殿物をセライト濾過により除去した後、濾液を酢酸エチルで抽出した。有機相を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (n-ヘキサン/酢酸エチル = 20/1) により精製し、淡黄色粉末の 1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン (1.33 g、収率 30%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.50-2.04 (10 H, m), 2.68-2.80 (2 H, m), 2.78 (3 H, s), 3.50-3.70 (4 H, m), 3.85-4.03 (1 H, m), 5.31 (1 H, t,  $J=5.7$  Hz), 6.72 (2 H, d,  $J=9.1$  Hz), 6.90 (2 H, d,  $J=9.2$  Hz), 6.98 (2 H, d,  $J=9.2$  Hz), 7.17 (2 H, d,  $J=9.1$  Hz)。

## 参考例 2

4- {4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン-1-イル} フェノールの製造

1- [4- (テトラヒドロピラン-2-イルオキシ) フェニル] -4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン (1.33 g、3.32 ミリモル) をエタノール (80 ml) に懸濁し、ピリジニウム p-トルエンスルホナート (0.25 g、1 ミリモル) を加え、70 °C で 8 時間攪拌した。エタノールを減圧留去して残渣に塩化メチレン及び飽和炭酸水素ナトリウム水溶液を加え攪拌した。これを塩化メチレンで抽出し、硫酸マグネシウムで乾燥後、濾過した。得られた濾液を減圧濃縮後、残渣に塩化メチレンおよび n-ヘキサンを加えて攪拌し生成した沈殿を濾取して、薄ピンク色粉末の 4- {4- [N- (4-クロロフェニル) -N-メチルアミノ] ピペリジン-1-イル} フェノール (922.5 mg、収率 88%) を得た。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.79-2.04 (4 H, m), 2.67-2.79 (2 H, m), 2.79 (3 H,

s), 3.56-3.68 (2H, m), 4.48 (1H, s), 6.69-6.80 (4H, m), 6.85-6.92 (2H, m), 7.14-7.21 (2H, m)。

## 【0329】

参考例 1 及び参考例 2 と同様にして以下の化合物を製造した。以下の表において、Ph とあるのはフェニル基又はフェニレン基を意味する。

## 【0330】

## 参考例 3

(4-クロロフェニル) - (4-ヒドロキシフェニル) メタノン O-メチルオキシム  
Ms: 261 (M<sup>+</sup>)。

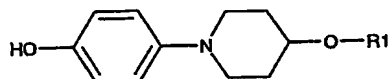
## 【0331】

## 参考例 4

(4-ヒドロキシフェニル) - (4-トリフルオロメチルフェニル) メタノン O-メチルオキシム  
Ms: 295 (M<sup>+</sup>)。

## 【0332】

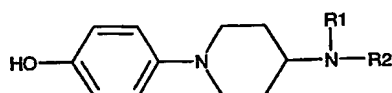
## 【表 1】



参考例 R1	<sup>1</sup> H NMR or MS
5 -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.79-1.89(2H, m), 2.01-2.08(2H, m), 2.77-2.87(2H, m), 3.33-3.41(2H, m), 3.53-3.56(2H, m), 4.59(2H, s), 4.63(1H, brs), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=9.0Hz), 7.27-7.36(5H, m).
6 4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.76-1.90(2H, m), 2.00-2.10(2H, m), 2.84(2H, m), 3.33-3.42(2H, m), 3.51-3.60(1H, m), 4.53(1H, brs), 4.63(2H, s), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=9.0Hz), 7.48(2H, d, J=8.1Hz), 7.60(2H, d, J=8.2Hz).
7 4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.71-1.93(2H, m), 1.95-2.15(2H, m), 2.71-2.93(2H, m), 3.26-3.46(2H, m), 3.46-3.63(1H, m), 4.50(1H, s), 4.57(2H, s), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=8.9Hz), 7.19(2H, d, J=8.5Hz), 7.39(2H, d, J=8.4Hz).
8 4-ClPhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.69-1.91(2H, m), 1.95-2.14(2H, m), 2.72-2.90(2H, m), 3.26-3.44(2H, m), 3.44-3.63(1H, m), 4.46(1H, broad s), 4.54(2H, s), 6.74(2H, d, J=9.0Hz), 6.87(2H, d, J=9.0Hz), 7.20-7.33(4H, m).
9 3,4-Cl <sub>2</sub> PhCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.71-1.93(2H, m), 1.93-2.18(2H, m), 2.70-2.93(2H, m), 3.22-3.45(2H, m), 3.45-3.65(1H, m), 4.52(2H, s), 4.85(1H, brs), 6.73(2H, d, J=9.0Hz), 6.82(2H, d, J=9.0Hz), 7.19(1H, dd, J=8.2Hz, 2.0Hz), 7.41(1H, d, J=8.2Hz), 7.46(1H, d, J=1.9Hz).
10 4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	Ms:381(M <sup>+</sup> )
11 4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	Ms:393(M <sup>+</sup> )
12 4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	Ms:395(M <sup>+</sup> )

## 【0333】

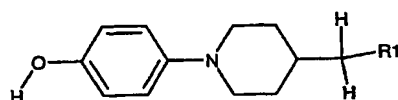
【表 2】



参考例 R1	R2	NMR or MS
13 4-ClPh-	-CH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.79-2.04(4H, m), 2.67-2.79(2H, m), 2.79(3H, s), 3.56-3.68(2H, m), 4.48(1H, s), 6.69-6.80(4H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.14-7.21(2H, m).
14 4-CF <sub>3</sub> Ph-	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.56-1.72(2H, m), 2.13-2.20(2H, m), 2.77-2.88(2H, m), 3.44-3.51(3H, m), 3.92(1H, d, J=7.94Hz), 4.86(1H, s), 6.59-6.63(2H, m), 6.72-6.79(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.38-7.42(2H, m).
15 -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	<sup>1</sup> H NMR (ODCl <sub>3</sub> ) δ 1.26-2.46(3H, m), 2.51-2.80(3H, m), 3.36-3.56(2H, m), 3.86(2H, s), 6.65-6.79(2H, m), 6.79-6.91(2H, m), 7.15-7.43(5H, m).
16 4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.34-1.87(2H, m), 1.88-2.11(2H, m), 2.51-2.74(3H, m), 3.26-3.57(m, 2H), 3.82(2H, s), 6.66-6.79(2H, m), 6.79-6.92(2H, m), 7.09-7.41(4H, m).
17 3,4-Cl <sub>2</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.34-1.80(2H, m), 1.89-2.10(2H, m), 2.50-2.80(3H, m), 3.31-3.54(2H, m), 3.81(2H, s), 6.65-6.79(2H, m), 6.80-6.90(2H, m), 7.11-7.23(1H, d, J=8.0Hz), 7.33-7.42(1H, d, J=8.2Hz), 7.43-7.50(1H, d, J=2.0Hz).
18 4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.40-1.86(2H, m), 1.87-2.12(2H, m), 2.50-2.80(3H, m), 3.38-3.56(2H, m), 3.92(2H, s), 6.66-6.80(2H, m), 6.80-6.93(2H, m), 7.47(2H, d, J=8.2Hz), 7.58(2H, d, J=8.1Hz).
19 4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.45-1.70(2H, m), 1.88-2.16(2H, m), 2.48-2.83(3H, m), 3.33-3.57(2H, m), 3.85(2H, s), 6.62-6.78(2H, m), 6.80-6.93(2H, m), 7.17(2H, d, J=8.4Hz), 7.37(2H, d, J=8.5Hz).
20 4-CH <sub>3</sub> OPh-	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.53-1.69(2H, m), 2.13-2.19(2H, m), 2.75-2.86(2H, m), 3.37-3.51(3H, m), 3.63(1H, d, J=7.86Hz), 4.48(1H, s), 6.53-6.61(2H, m), 6.72-6.80(2H, m), 6.85-6.92(2H, m), 7.01-7.05(2H, m).
21 4-ClPh-	-H	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.52-1.68(2H, m), 2.13-2.18(2H, m), 2.75-2.86(2H, m), 3.35-3.56(4H, m), 4.59(1H, brs), 6.51-6.58(2H, m), 6.70-6.79(2H, m), 6.85-6.93(2H, m), 7.10-7.15(2H, m).
22 -CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>3</sub>	Ms:296(M <sup>+</sup> )
23 4-CH <sub>3</sub> OPh-	-CH <sub>3</sub>	Ms:366(M <sup>+</sup> )
24 4-CF <sub>3</sub> Ph-	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Ms:366(M <sup>+</sup> )
25 4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Ms:426(M <sup>+</sup> )
26 (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	-H	Ms; 292(M <sup>+</sup> )
27 (CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Ms; 320(M <sup>+</sup> )

【0334】

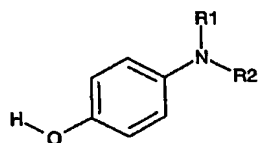
【表 3】



参考例 R1	NMR or MS
28 -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	Ms; 267(M <sup>+</sup> ) <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.48—1.63(2H, m), 1.87—1.98(3H, m), 2.62—2.72(2H, m),
29 4-CF <sub>3</sub> OPhO-	3.51—3.57(2H, m), 3.83(2H, d, J=5.88Hz), 4.50(1H, brs), 6.73—6.78(2H, m), 6.84—6.91(4H, m), 7.12—7.16(2H, m). <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.36—1.90(5H, m), 2.56—2.68(2H, m), 3.38(2H, d, J=6.31Hz),
30 4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> O-	3.44—3.53(2H, m), 4.51(2H, s), 4.66(1H, brs), 6.70—6.77(2H, m), 6.83—6.89(2H, m), 7.17—7.21(2H, m), 7.34—7.39(2H, m).
31 4-CF <sub>3</sub> OPh-	Ms; 351(M <sup>+</sup> ) <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.31—1.86(5H, m), 2.43—2.77(4H, m), 3.34—3.58(2H, m),
32 4-CF <sub>3</sub> Ph-	4.57(1H, brs), 6.66—6.80(2H, m), 6.80—6.92(2H, m), 7.28(2H, d, J=7.7Hz), 7.55(2H, d, J=8.1Hz).
33 4-ClPh-	Ms; 301(M <sup>+</sup> )
34 3,4-Cl <sub>2</sub> Ph-	Ms; 335(M <sup>+</sup> ) <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.34—1.51(2H, m), 1.68—1.90(3H, m), 2.56—2.67(2H, m),
35 4-ClPhCH <sub>2</sub> O-	3.36(2H, d, J=6.36Hz), 3.46—3.52(2H, m), 4.43(1H, s), 4.48(2H, s), 6.71—6.78(2H, m), 6.83—6.89(2H, m), 7.27—7.34(4H, m). <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.37—1.54(2H, m), 1.68—1.90(3H, m), 2.57—2.68(2H, m),
36 4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> O-	3.39(2H, d, J=6.29Hz), 3.46—3.52(2H, m), 4.57(2H, s), 5.28(1H, s), 6.67—6.74(2H, m), 6.83—6.89(2H, m), 7.43—7.47(2H, m), 7.58—7.62(2H, m). <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.48—1.63(2H, m), 1.86—1.98(3H, m), 2.61—2.71(2H, m),
37 4-ClPhO-	3.51—3.56(2H, m), 3.82(2H, d, J=5.95Hz), 4.49(1H, s), 6.73—6.91(6H, m), 7.19—7.25(2H, m). <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.38—1.54(2H, m), 1.64—1.79(1H, m), 1.89(2H, d, J=12.9Hz),
38 4-CF <sub>3</sub> PhNH-	2.62(2H, dt, J=1.99, 11.98Hz), 3.11(2H, t, J=6.27Hz), 3.52(2H, d, J=11.98Hz), 4.00— 4.18(1H, brm), 4.46(1H, brs), 4.39—4.55(1H, brs), 6.60(2H, d, J=8.56Hz), 6.75(2H, d, J=8.89Hz), 6.87(2H, d, J=8.89Hz), 7.40(2H, d, J=8.56Hz) <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.37—1.57(2H, m), 1.61—1.77(1H, m), 1.79—1.97(2H, m),
39 4-ClPhNH-	2.52—2.70(2H, m), 3.04(2H, d, J=6.70Hz), 3.51(2H, d, J=11.98Hz), 3.76—4.76(2H, br), 6.48—6.58(2H, m), 6.71—6.81(2H, m), 6.83—6.92(2H, m), 7.08—7.17(2H, m) <sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.37—1.81(4H, m), 1.90(2H, d, J=6.20Hz), 2.63(2H, t, J=11.68Hz), 3.05(2H, d, J=6.66Hz), 3.52(2H, d, J=11.99Hz), 3.69—4.07(1H, br), 4.18 —4.74(1H, br), 6.49—6.63(2H, m), 6.67—6.82(2H, m), 6.87(2H, d, J=8.64Hz), 7.03(2H, d, J=8.64Hz)
40 4-CF <sub>3</sub> OPhNH-	<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.35—1.45(2H, m), 1.68—1.80(3H, m), 2.46—2.56(2H, m),
41 4-ClPhNHCO-	3.40—3.46(2H, m), 4.00(2H, d, J=5.90Hz), 6.61—6.65(2H, m), 6.67—6.81(2H, m), 7.31—7.35(2H, m), 7.45—7.51(2H, m), 8.78(1H, s), 9.79(1H, s).

【0335】

【表 4】



参考例	R1	R2	NMR
42	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> -	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.58(1H, brs), 3.89(2H, d, J=5.7Hz), 4.24(1H, brs), 6.31(1H, dt, J=15.9, 5.7Hz), 6.57-6.62(3H, m), 6.69-6.73(2H, m), 7.13-7.16(2H, m), 7.36-7.38(2H, m).

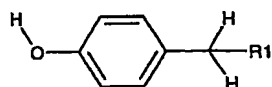
【0336】

【表 5】

参考例	R1	R2	NMR
43	-H		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.21-1.36(2H, m), 1.46(9H, s), 1.94-2.08(2H, m), 2.78-3.00(2H, brm), 3.08-3.26(1H, br), 3.27-3.38(1H, m), 3.87-4.22(2H, br), 4.29-4.58(1H, br), 6.50-6.58(2H, m), 6.66-6.75(2H, m)
44	-H		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.44-1.59(2H, m), 2.16(2H, d, J=11.54Hz), 2.92-3.03(2H, m), 3.14-3.32(1H, brs), 3.34-3.47(1H, m), 3.77(2H, d, J=12.96Hz), 4.15-4.33(1H, brs), 6.57(2H, d, J=8.68Hz), 6.72(2H, d, J=8.68Hz), 6.94(2H, d, J=8.76Hz), 7.47(2H, d, J=8.76Hz)
45	-H		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.44-1.64(2H, m), 2.07-2.22(2H, m), 2.78-2.93(2H, m), 3.25-3.40(1H, m), 3.53-3.67(2H, m), 6.52-6.63(2H, m), 6.67-6.76(2H, m), 6.81-6.91(2H, m), 7.14-7.24(2H, m)
46	-H		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.41-1.66(2H, m), 2.09-2.24(2H, m), 2.80-2.97(2H, m), 3.11-3.30(1H, brs), 3.30-3.42(1H, m), 3.53-3.70(2H, m), 4.16-4.34(1H, brs), 6.50-6.62(2H, m), 6.66-6.77(2H, m), 6.85-6.97(6H, m), 7.03-7.17(2H, m)
47	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.70-1.96(4H, brs), 2.59-2.86(5H, m), 3.37-3.58(1H, m), 3.60-3.82(2H, m), 4.36(1H, s), 6.63-6.92(6H, m), 7.15-7.23(2H, m)
48	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.75-1.92(4H, brs), 2.64-2.84(5H, m), 3.37-3.52(1H, m), 3.63-3.79(2H, m), 4.39(1H, s), 6.67-6.87(4H, m), 6.87-6.94(2H, m), 7.06-7.14(2H, m)
49	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.05(3H, t, J=6.94Hz), 1.65-1.82(2H, m), 1.82-1.99(2H, m), 2.65-2.83(2H, m), 3.04-3.27(2H, brs), 3.27-3.46(1H, brs), 3.56-3.80(2H, brm), 4.27-4.69(1H, brs), 6.63-6.94(6H, m), 7.03-7.14(2H, m)
50	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 2.90(3H, s), 4.00(2H, d, J=5.4Hz), 4.29(1H, brs), 6.34(1H, dt, J=15.9, 5.4Hz), 6.55(1H, d, J=15.9Hz), 6.71-6.79(4H, m), 7.42-7.44(2H, m), 7.53-7.55(2H, m)
51	-CH <sub>3</sub>		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.72-1.91(4H, m), 2.72(3H, s), 2.79-2.93(2H, m), 3.45-3.56(1H, m), 3.87(2H, d, J=12.74Hz), 4.38(1H, s), 6.79(2H, d, J=8.93Hz), 6.82(2H, d, J=8.93Hz), 6.93(2H, d, J=8.76Hz), 7.47(2H, d, J=8.76Hz)

【0337】

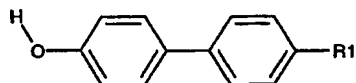
【表 6】



参考例	R1	NMR
52	4-CF <sub>3</sub> Ph-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.96(2H, s), 4.66(1H, s), 6.75-6.79(2H, m), 7.01-7.06(2H, m), 7.26-7.29(2H, m), 7.51-7.54(2H, m).
53	4-ClPh-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.87(3H, brs), 6.74-6.78(2H, m), 7.01-7.04(2H, m), 7.07-7.10(2H, m), 7.22-7.26(2H, m).

【0338】

【表 7】



参考例	R1	NMR or MS
54		Ms; 406(M <sup>+</sup> )
55		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.17(3H, t, J=7.01Hz), 1.84-1.96(4H, m), 2.79-2.91(2H, m), 3.31(3H, q, J=7.01Hz), 3.61-3.78(1H, m), 3.81-3.86(2H, m), 4.73(1H, s), 6.69-6.75(2H, m), 6.84-6.91(2H, m), 6.99-7.11(4H, m), 7.41-7.48(4H, m).
56		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.21(3H, t, J=7.03Hz), 1.90-1.98(4H, m), 2.81-2.93(2H, m), 3.37(3H, q, J=7.03Hz), 3.74-3.88(3H, m), 4.75(1H, s), 6.73-6.79(2H, m), 6.84-6.91(2H, m), 6.98-7.04(2H, m), 7.42-7.49(6H, m).
57		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 3.33(3H, s), 4.80(1H, brs), 6.87-6.91(2H, m), 6.96-7.02(2H, m), 7.07-7.14(4H, m), 7.42-7.51(4H, m).
58		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.88-2.02(2H, m), 2.07-2.18(2H, m), 3.09-3.20(2H, m), 3.49-3.59(2H, m), 4.41-4.50(1H, m), 4.74(1H, s), 6.84-6.95(4H, m), 6.98-7.03(2H, m), 7.12-7.17(2H, m), 7.40-7.48(4H, m).
59		<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 6.82-6.86(2H, m), 7.08-7.20(8H, m), 7.39-7.49(4H, m), 7.59-7.72(6H, m), 9.53(1H, s).
60		<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 4.73(1H, s), 6.88-6.93(2H, m), 7.01-7.13(4H, m), 7.17-7.22(2H, m), 7.43-7.55(4H, m).

【0339】



## 実施例1

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペラジン-1-イル]ベンゾチアゾール-6-イルオキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロ-1H-イミダゾール(51mg, 0.23ミリモル)及び6-ヒドロキシ-2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペラジン-1-イル]-ベンゾチアゾール(80mg, 0.20ミリモル)を、DMF(5ml)に溶解し、水素化ナトリウム(10mg, 0.25ミリモル)を加え、60℃で1.5時間攪拌した。室温に放冷後、反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出。合わせた有機層を、水、飽和食塩水で洗浄後、硫酸ナトリウムで乾燥。これを濾別後、濾液を減圧濃縮。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(n-ヘキサン:酢酸エチル=1:3→酢酸エチル)で精製し、エタノールから再結晶し、無色粉末結晶の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)-ピペラジン-1-イル]ベンゾチアゾール-6-イルオキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール(40mg、収率33%)を得た。

融点: 205.6-207.4℃。

【0340】

## 実施例2

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ピリジン-5-オキシ}メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールの製造

5-ヒドロキシ-2-{4-[4-(トリフルオロメトキシ)フェノキシ]ピペリジン-1-イル}ピリジン0.67g(1.9ミリモル)及び(R)-2-クロロ-1-(2-メチルオキシラニルメチル)-4-ニトロ-1H-イミダゾール0.51g(2.4ミリモル)をDMF6.7mlに溶解した。これに水素化ナトリウム91mg(2.3ミリモル)を加え、50~55℃にて1時間加熱攪拌した。反応液に水を入れ、塩化メチレンで抽出した。有機層を飽和食塩水で洗浄、硫酸マグネシウムで乾燥後、吸引濾過した。得られた濾液を減圧下にて濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(塩化メチレン/酢酸エチル=10/0、9/1、8/2)で分離精製し、更に塩化メチレン/ジイソプロピルエーテル/酢酸エチルによる結晶化により、淡黄色粉末の(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{2-[4-(4-トリフルオロメトキシフェノキシ)ピペリジン-1-イル]ピリジン-5-オキシ}メチル-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾールを0.30g(29%)得た。

<sup>1</sup>H-NMR(CDCl<sub>3</sub>) δ ppm:

1.77(3H, s), 1.80-1.94(2H, m), 1.94-2.17(2H, m), 3.21-3.44(2H, m), 3.67-3.89(2H, m), 3.96-4.11(2H, m), 4.19(1H, d, J=10.4Hz), 4.36-4.59(2H, m), 6.65(1H, d, J=9.2Hz), 6.83-6.97(2H, m), 7.02-7.20(3H, m), 7.56(1H, s), 7.87(1H, d, J=3.0Hz)。

【0341】

上記実施例2と同様にして以下の化合物を製造した。以下の表において、Phとあるのはフェニル基又はフェニレン基を意味する。

【0342】

## 実施例3

(R)-2-(4-{4-[N-(4-クロロフェニル)-N-メチルアミノ]ピペリジン-1-イル}フェノキシメチル)-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 173.7-175.1℃。

## 【0343】

## 実施例4

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.23-1.52 (2H, m), 1.52-1.66 (3H, m), 1.66-1.89 (5H, m), 2.43-2.70 (4H, m), 3.50 (2H, d,  $J=12.1$  Hz), 3.91-4.09 (2H, m), 4.16 (1H, d,  $J=10.1$  Hz), 4.48 (1H, d,  $J=10.2$  Hz), 6.66-6.81 (2H, m), 6.81-6.95 (2H, m), 6.81-6.95 (2H, m), 7.05-7.23 (4H, m), 7.54 (1H, s)

融点: 210.9-212.4°C

$[\alpha]_D = -9.0^\circ$  (濃度: 1.0,  $\text{CHCl}_3$ )。

## 【0344】

## 実施例5

(R)-2-{4-[4-(3,4-ジクロロベンジル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2-メチル-6-ニトロ-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

$^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  ppm:

1.24-1.52 (2H, m), 1.52-1.64 (4H, m), 1.64-1.73 (1H, m), 1.73-1.87 (4H, m), 2.38-2.68 (4H, m), 3.49 (2H, d,  $J=12.1$  Hz), 3.91-4.09 (2H, m), 4.16 (1H, d,  $J=10.2$  Hz), 4.49 (1H, d,  $J=10.2$  Hz), 6.67-6.81 (2H, m), 6.81-6.92 (2H, m), 6.94-7.07 (1H, m), 7.25 (1H, s), 7.35 (1H, d,  $J=8.2$  Hz), 7.55 (1H, s)

融点: 180.0-181.2°C

$[\alpha]_D = -8.5^\circ$  (濃度: 1.0,  $\text{CHCl}_3$ )。

## 【0345】

## 実施例6

(R)-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメトキシベンジロキシメチル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 140.4-141.7°C。

## 【0346】

## 実施例7

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-{4-[4-(4-トリフルオロメチルベンジロキシメチル)ピペリジン-1-イル]フェノキシメチル}-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 172.3-172.9°C。

## 【0347】

## 実施例8

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-{4-[3-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-プロペニル]ピペラジン-1-イル}フェノキシメチル)-2,3-ジヒドロイミダゾ[2,1-b]オキサゾール

融点: 199.7-202°C。

## 【0348】

## 実施例9

(R)-2-メチル-6-ニトロ-2-(4-{4-[2-(4-トリフルオロメトキシ

フェノキシ) エチル] ピペラジン-1-イル} フェノキシメチル) - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 194.8-195.6℃。

【0349】

実施例 10

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4-クロロフェニル) - N-エチルアミノ] ピペリジン-1-イル} フェノキシメチル) - 2-メチル - 6-ニトロ - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 121.4-125℃。

【0350】

実施例 11

(R) - 2 - (4 - {4 - [N-エチル-N- (4-トリフルオロメトキシフェニル) アミノ] ピペリジン-1-イル} フェノキシメチル) - 2-メチル - 6-ニトロ - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 122.5-122.8℃。

【0351】

実施例 12

(R) - 2 - (4 - {4 - [N-エチル-N- (4-トリフルオロメチルフェニル) アミノ] ピペリジン-1-イル} フェノキシメチル) - 2-メチル - 6-ニトロ - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 105-108.5℃。

【0352】

実施例 13

(R) - 2 - {4 - [4 - (5-クロロベンゾフラン-2-イルメチル) ピペラジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2-メチル - 6-ニトロ - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 210.6-211.6℃。

【0353】

実施例 14

(R) - 2-メチル - 6-ニトロ - 2 - {2 - [4 - (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペラジン-1-イル] ベンゾチアゾール-6-イルオキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 203.9-205.2℃。

【0354】

実施例 15

2-メチル - 6-ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4-トリフルオロメトキシベンジル) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 180.9-182.7℃。

【0355】

実施例 16

2 - {4 - [4 - (3, 4-ジクロロベンジル) ピペリジン-1-イル] フェノキシメチル} - 2-メチル - 6-ニトロ - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 191.4-192.1℃。

【0356】

実施例 17

2 - (4 - {4 - [N - (4-クロロフェニル) - N-メチルアミノ] ピペリジン-1-イル} フェノキシメチル) - 2-メチル - 6-ニトロ - 2, 3-ジヒドロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール  
融点: 137.6-141.5℃。

## 【0357】

## 実施例 18

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] ピペリジン - 1 - イル} フェノキシメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール 4 - トルエンスルホン酸塩  
融点: 212.6 - 214.1℃。

## 【0358】

## 実施例 19

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] ピペリジン - 1 - イル} フェノキシメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール メタンスルホン酸塩  
融点: 171.2 - 172.8℃。

## 【0359】

## 実施例 20

(R) - 2 - (4 - {4 - [N - (4 - クロロフェニル) - N - メチルアミノ] ピペリジン - 1 - イル} フェノキシメチル) - 2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール 塩酸塩  
融点: 170.0 - 173.7℃。

## 【0360】

## 実施例 21

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフリオロメトキシベンジルオキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール  
融点: 153.1 - 153.7℃。

## 【0361】

## 実施例 22

(R) - (4 - クロロフェニル) カルバミン酸 1 - [4 - (2 - メチル - 6 - ニトロ - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール - 2 - イルメトキシ) フェニル] ピペリジン - 4 - イルメチルエステル  
融点: 211.6 - 212.3℃ (分解)。

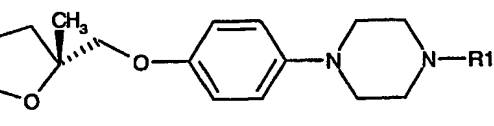
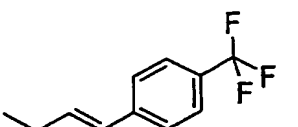
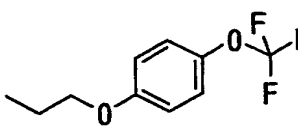
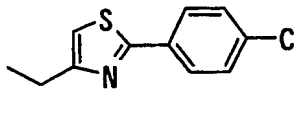
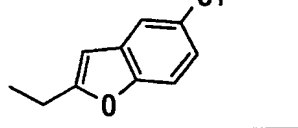
## 【0362】

## 実施例 23

2 - メチル - 6 - ニトロ - 2 - {4 - [4 - (4 - トリフリオロメチルベンジルオキシメチル) ピペリジン - 1 - イル] フェノキシメチル} - 2, 3 - ジヒドロイミダゾ [2, 1 - b] オキサゾール  
融点: 138.7 - 139.5℃。

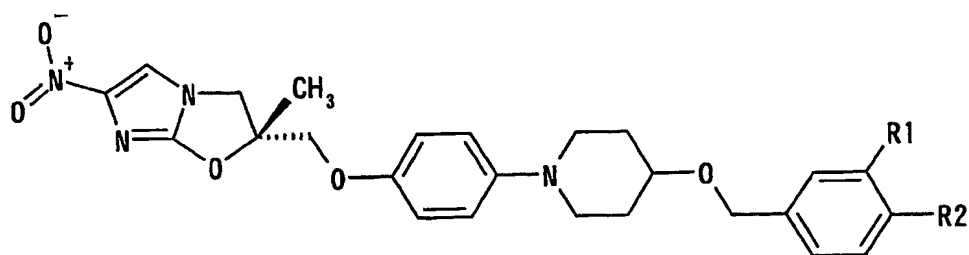
## 【0363】

【表 8】

実施例	R1	mp(°C)
24		210.0 - 212.1
25		199.7 - 202.0
26		194.8 - 195.6
27		197.1 - 198.6
28		210.6 - 211.6

【0364】

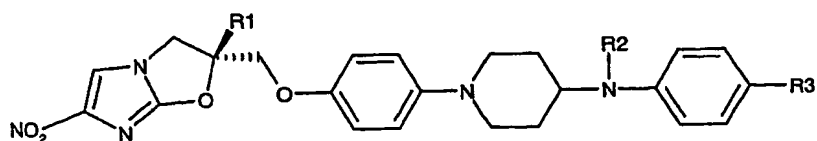
【表 9】



実施例	R1	R2	mp(°C)
29	-H	-H	210.9 - 213.8
30	-H	-OCF <sub>3</sub>	214.3 - 217.7
31	-H	-CF <sub>3</sub>	217.4 - 219.7
32	-H	-Cl	208.7 - 211.6
33	-Cl	-Cl	198.9 - 202.0

【0365】

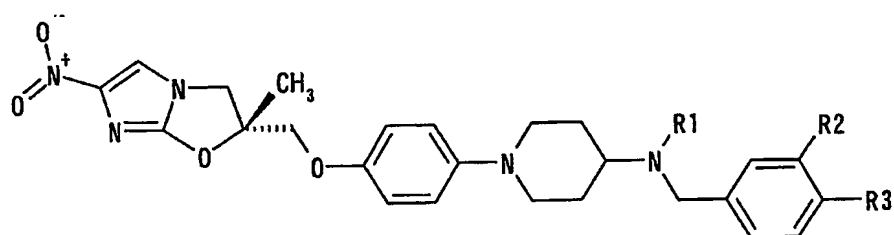
【表10】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
34	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-Cl	173.7 - 175.1
35	-CH <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	178.4 - 181.1 dec
36	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	135.0 - 137.5
37	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCF <sub>3</sub>	195.4 - 197.8 dec
38	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-OCF <sub>3</sub>	158.1 - 158.8
39	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	187.0 - 189.5
40	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-Cl	121.4 - 125.0
41	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	105.0 - 108.5
42	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-H	192.5 - 195.3
43	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	-CF <sub>3</sub>	147.3 - 148.6
44	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	89.5 - 93.4
45	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	-CF <sub>3</sub>	103.4 - 107.9
46	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-Cl	122.1-124.0
47	-CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub> CO-	-CF <sub>3</sub>	124.7 - 127.0
48	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	-CF <sub>3</sub>	157.6 - 160.4
49	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-CF <sub>3</sub>	117.8 - 120.2
50	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-OCF <sub>3</sub>	122.5 - 122.8
51	-H	-CH <sub>3</sub>	-OCF <sub>3</sub>	154.0 - 157.3 dec
52	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-CF <sub>3</sub>	172.0 - 174.2
53	-H	-CH <sub>3</sub>	-CF <sub>3</sub>	189.4 - 190.8
54	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	179.2 - 180.7
55	-H	-CH <sub>3</sub>	-Cl	203.6 - 204.5 dec

【0366】

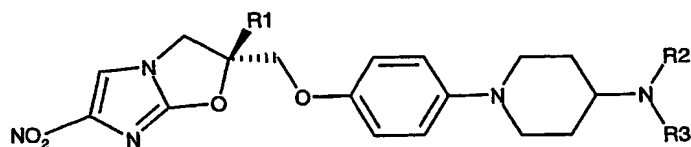
【表 11】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
56	-H	-H	-H	215.9 - 217.2
57	-H	-H	-Cl	211.7 - 213.1
58	-H	-Cl	-Cl	199.5 - 204.0
59	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	213.5 - 216.5
60	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	217.6 - 218.4
61	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	195.4 - 199.1
62	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCF <sub>3</sub>	204.8 - 207.0
63	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	206.1 - 208.9
64	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	182.1 - 185.7
65	-CH <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	199.6 - 202.0
66	-COCH <sub>3</sub>	-H	-Cl	169.9 - 117.4
67	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-H	-OCF <sub>3</sub>	115.4 - 117.4
68	-COCH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.42-1.87(8H, m), 2.11(3H, brs), 2.53-2.77(2H, m), 3.52(2H, d, J=12.4Hz), 4.15(1H, d, J=11.9Hz), 4.17(2H, s), 4.35(1H, d, J=10.9Hz), 4.51(2H, brs), 6.63-6.91(4H, m), 7.11-7.28(1H, m), 7.35-7.61(3H, m), 8.01(1H, s).
69	-CO <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	137.0 - 140.0
70	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	159.9 - 162.8
71	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	132.5 - 136.7

【0367】

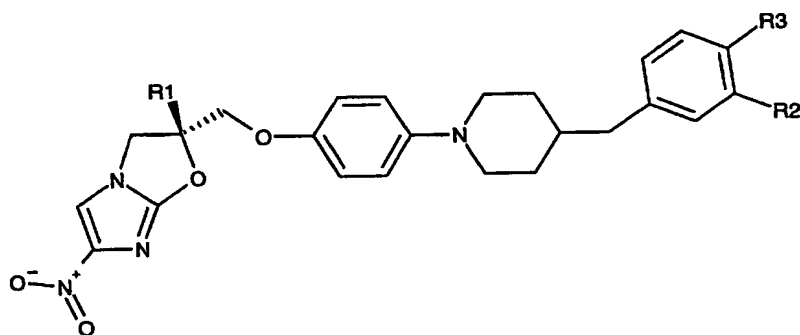
【表 12】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
72	-CH <sub>3</sub>	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	250.7 - 254.0
73	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	232.0 - 237.5
74	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	165.0 - 167.2
75	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	161.2 - 163.5
76	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	194.9 - 196.7
77	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	212.3 - 214.7 dec
78	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	144.0
79	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	172.2 - 173.0
80	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	212.4 - 214.5 dec
81	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCO-	205.5 - 208.0
82	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	232.0 - 237.5 dec
83	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	201.0 - 203.7
84	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> OCO-	201.0 - 203.5

【0368】

【表 13】

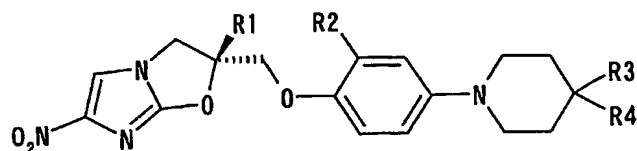


実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
85	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	209.7 - 212.4
86	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCF <sub>3</sub>	210.7 - 214.0
87	-CH <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	199.5 - 203.1
88	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	207.1 - 211.2
89	-CH <sub>3</sub>	-Cl	-Cl	180.1 - 184.4

【0369】



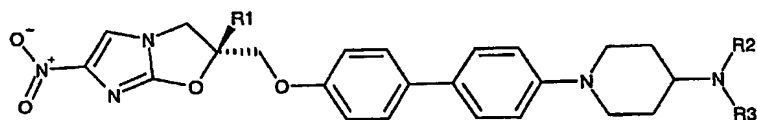
【表 14】



実施例	R1	R2	R3	R4	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
90	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OH	228.0 - 229.5 dec
91	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	218.5 - 219.0 dec
92	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CO <sub>2</sub> H	<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.69(3H, s), 2.11(4H, brs), 2.64(1H, brs), 3.48(4H, brs), 4.20(1H, d, J = 11.0Hz), 4.34(2H, s), 4.37(1H, d, J = 11.0Hz), 7.03-7.08(2H, m), 7.69(2H, br), 8.16(1H, s), 12.44(1H, br).
93	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhNHCO-	251.0 - 254.7 dec
94	-CH <sub>3</sub>	-H	-OH	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	242.7 - 243.5
95	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	185.0 - 186.1
96	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhOCH <sub>2</sub> -	226.2 - 226.9 dec
97	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	263.0 - 265.1
98	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> O-	171.8 - 174.2
99	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH=CHCH <sub>2</sub> O-	213.7 - 217.4
100	-CH <sub>3</sub>	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	153.0 - 156.8
101	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPh-	-OH	231.3 - 231.9
102	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhOCH <sub>2</sub> -	223.2 - 225.2 dec
103	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> O-	196.8 - 200.0
104	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	175.3 - 175.5
105	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	172.3 - 172.9
106	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> -	140.4 - 141.7
107	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> O-	188.3-189.4
108	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhOCH <sub>2</sub> -	220.2 - 223.1
109	-H	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhOCH <sub>2</sub> -	175.0 - 180
110	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	NH <sub>2</sub> COO-	208.7-209.9 dec
111	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	3,4-Cl <sub>2</sub> PhNHCOO-	218.5 - 222.2 dec
112	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> PhNHCOO-	224.0 - 226.6 dec
113	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhNHCOO-	236.0 - 238.7 dec
114	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhNHCOO-	223.0 - 225.5
115	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	239.4 - 241.3
116	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> -	191.4 - 193.2
117	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhN(CH <sub>3</sub> )COO-	224.6 - 224.9
118	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhN(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )COO-	181.1 - 182.6
119	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhN(CH <sub>3</sub> )COOCH <sub>2</sub> -	195.6-195.9
120	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	4-ClPhN(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> )COOCH <sub>2</sub> -	165.0-166.0

【0370】

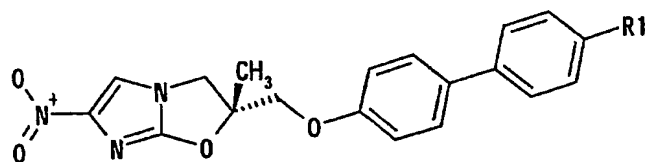
【表 15】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
121	-H	4-ClPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	217.6 - 219.4 dec
122	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	229.3 - 233.0 dec
123	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	221.8 - 223.8 dec
124	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	245.1 - 247.3 dec
125	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.21(3H, t, J=7.01Hz), 191-1.98(4H, m), 2.82-2.94(2H, m), 3.37(2H, q, J=7.01Hz), 3.74-3.89(3H, m), 4.30-4.51(4H, m), 5.58-5.69(1H, m), 6.74-6.79(2H, m), 6.90-6.95(2H, m), 6.99-7.04(2H, m), 7.42-7.52(6H, m).
126	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	251.8 - 253.5 dec

【0371】

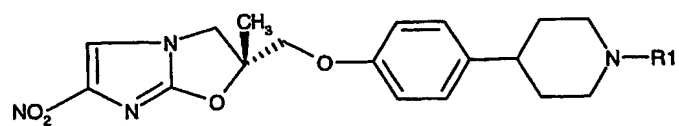
【表 16】



実施例	R1	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
127	-H	237.7 - 239.6
128		229.0 - 230.5 dec
129		252.3 - 253.6 dec
130		<sup>1</sup> H NMR (DMSO) δ 1.71(3H, s), 4.21(1H, d, J=11.03Hz), 4.34(2H, s), 4.40(1H, d, J=11.03Hz), 6.99(2H, d, J=8.44Hz), 7.10-7.20(8H, m), 7.42(2H, d, J=8.44Hz), 7.57-7.72(8H, m), 8.22(1H, s).
131		218.0 - 221.0 dec

【0372】

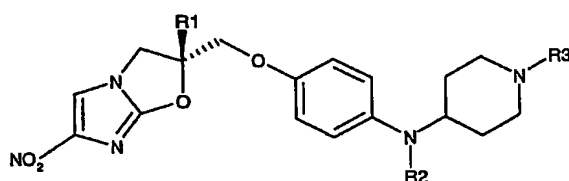
【表 17】



実施例	R1	mp(°C)
132		185.9 - 187.1
133		190.5 - 191.3
134		194.6 - 196.4
135		219.9 - 220.5

【0373】

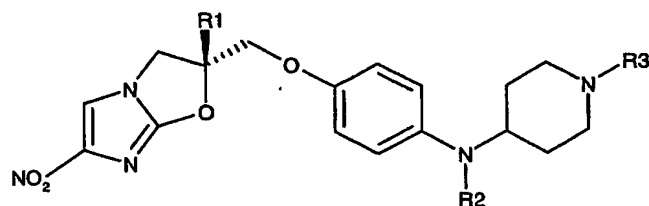
【表 18】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
136	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	167.8-168.7
137	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	154.8-155.9
138	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	149.6-153.4
139	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	145.0-146.9
140	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	141.8-144.3
141	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	132.4-135.0
142	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> OCO-	152.2-155.6
143	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH=CHCH <sub>2</sub> -	160.5-163.7
144	-CH <sub>3</sub>	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	125.2-128.1
145	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	137.9-139.2
146	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	190.8-193.8
147	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> OPh-	145.6-149.3
148	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPh-	163.3-167.3
149	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhO(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	140.9-143.1
150	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	153.6-154.7
151	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	181.7 - 183.6
152	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	183.7 - 186.6
153	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	173.0 - 176.3
154	-CH <sub>3</sub>	-H	4-ClPhCH <sub>2</sub> OCO-	125.2 - 127.6
155	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	120.5 - 124.9
156	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> OCO-	103.5 - 107.3
157	-CH <sub>3</sub>	-H	4-CF <sub>3</sub> Ph-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.46-1.62(2H, m), 1.76(3H, s), 2.08-2.21(2H, m), 2.90-3.05(2H, m), 3.35-3.47(1H, m), 3.70-3.83(2H, m), 3.98-4.06(2H, m), 4.16(1H, d, J=10.20Hz), 4.50(1H, d, J=10.20Hz), 6.53-6.65(2H, m), 6.69-6.77(2H, m), 6.89-6.98(2H, m), 7.43-7.51(2H, m), 7.55(1H, s)
158	-CH <sub>3</sub>	-H	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.20-1.37(2H, m), 1.46(9H, s), 1.76(3H, s), 1.94-2.07(2H, brm), 2.77-3.01(2H, brm), 3.23-3.41(2H, brm), 3.94-4.11(4H, m), 4.14(1H, d, J=10.19Hz), 4.49(1H, d, J=10.15Hz), 6.50-6.59(2H, m), 6.67-6.76(2H, m), 7.55(1H, s)
159	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	129.2 - 132.0
160	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhNHCO-	179.0 - 182.5

【0374】

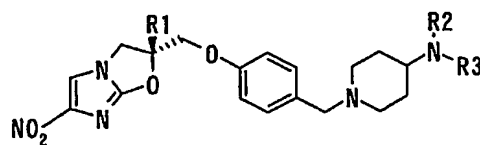
【表 19】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C)
161	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>		158.9-160.4
162	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>		143.0-146.5
163	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>		163.9-166.3
164	-CH <sub>3</sub>	-H		161.7-165.4
165	-CH <sub>3</sub>	-H		185.7-188.8

【0375】

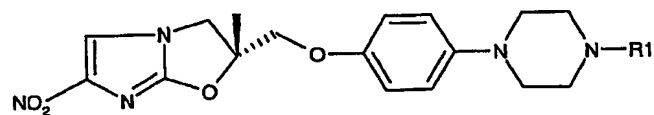
【表 20】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
				<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.62-1.73(2H, m), 1.73-1.87(5H, m), 1.96-2.12(2H, m), 2.77(3H, s), 2.88-3.03(2H, m), 3.38-3.60(3H, m), 4.00-4.13(2H, m), 4.23(1H, d, J=10.1Hz), 4.50(1H, d, J=10.2Hz), 6.67-6.74(2H, m), 6.76-6.84(2H, m), 7.02-7.10(2H, m), 7.18-7.25(2H, m), 7.56(1H, s)
166	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-CH <sub>3</sub>	
167	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> OCO-	-CH <sub>3</sub>	190.9-192.2
168	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	143.1-145.7
169	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCO-	-CH <sub>3</sub>	178.8-183.7
				<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.74-1.87(5H, m), 2.50-2.68(2H, m), 2.68-2.83(2H, m), 2.97(3H, s), 3.42-3.56(2H, m), 3.97-4.17(4H, m), 4.29(1H, d, J=10.3Hz), 4.50(1H, d, J=10.2Hz), 4.55-4.66(1H, m), 6.46-6.55(1H, br), 6.84-6.93(2H, m), 7.10-7.18(2H, m), 7.37-7.44(2H, m), 7.49-7.57(2H, m), 7.58(1H, s)
170	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhNHCO-	-CH <sub>3</sub>	

【0376】

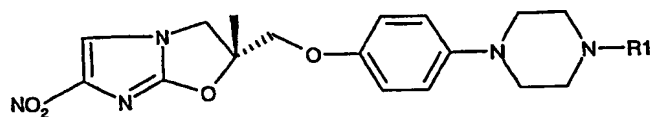
【表 21】



実施例	R1	MS(M+1)
171		500
172		519
173		471
174		485
175		470
176		442
177		455
178		574
179		492

【0377】

【表 22】

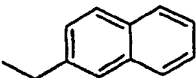
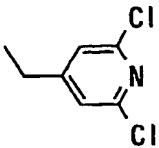
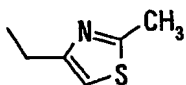
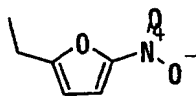
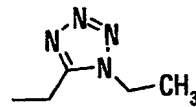
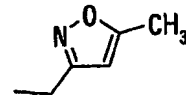
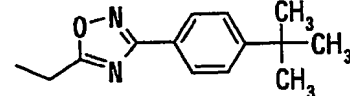
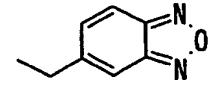
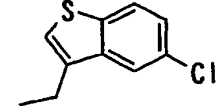
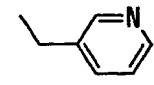
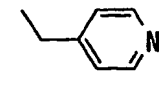


実施例	R1	MS(M+1)
180		476
181		478
182		451
183		451
184		451
185		601
186		490
187		564

【0378】

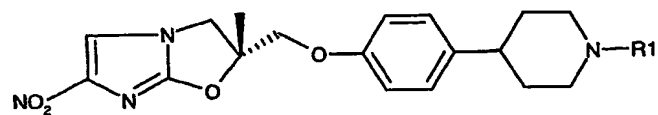


【表 23】

実施例	R1	MS(M+1)
188		499
189		518
190		470
191		484
192		469
193		454
194		573
195		491
196		539
197		450
198		450

【0379】

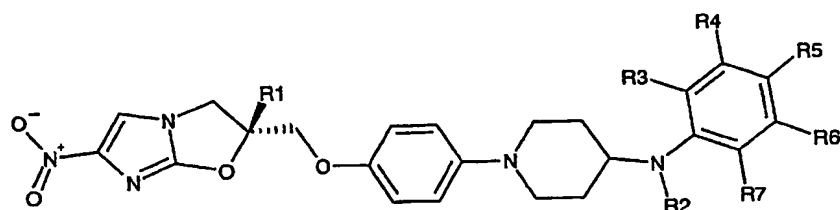
【表 24】



実施例	R1	MS(M+1)
199	 <chem>CC1=CC=CC=N1</chem>	450
200	 <chem>CC1=CC=C(C=C1)C2=NC(=S)C=C2</chem>	600
201	 <chem>CC1=CC=C(S1)Cl</chem>	489

【0380】

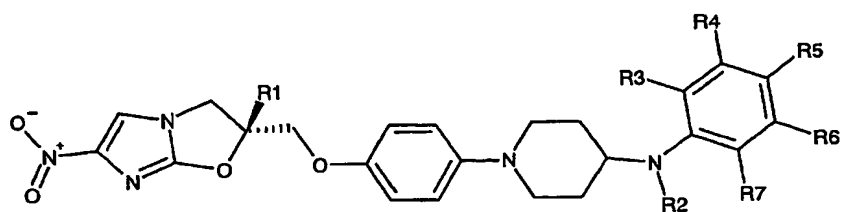
【表 25】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
202	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	-H	484
203	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-H	498
204	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	518
205	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	534
206	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	586
207	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	506
208	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-H	450
209	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-H	-H	480
210	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-Cl	484
211	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	-H	484
212	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	464
213	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	540
214	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	534
215	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-F	-H	-H	468
216	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	493
217	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	494
218	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	478
219	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	522
220	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	534
221	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	-OCH F <sub>2</sub>	516
222	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	-OCF <sub>3</sub>	568
223	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	542
224	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	518
225	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	518
226	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	518
227	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	-Cl	552
228	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-CH <sub>3</sub>	492
229	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-Cl	-H	514
230	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CF <sub>3</sub>	-H	-Cl	552
231	-CH <sub>3</sub>	-H	-F	-F	-F	-F	-F	540
232	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-NO <sub>2</sub>	-H	-H	495
233	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CN	-H	-H	475
234	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	496
235	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-Cl	-H	532
236	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	-H	548
237	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	-H	-H	520
238	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-H	464

【0381】

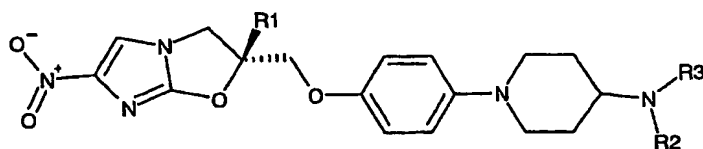
【表 26】



実施例	R1	R2	R3	R4	R5	R6	R7	MS(M+1)
239	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-Cl	498
240	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-H	498
241	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	478
242	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-OCH <sub>3</sub>	-H	554
243	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	-H	548
244	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-F	-H	-H	482
245	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	-H	-H	507
246	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	508
247	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	492
248	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-NHCOCH <sub>3</sub>	-H	-H	521
249	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-H	536
250	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-OCF <sub>3</sub>	548
251	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-H	-OCHF <sub>2</sub>	530
252	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-OCF <sub>3</sub>	582
253	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	-H	556
254	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-H	-Cl	-Cl	532
255	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-H	-Cl	532
256	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-Cl	-H	-Cl	-H	532
257	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-Cl	-Cl	-Cl	566
258	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-OCH <sub>3</sub>	-Cl	-H	528
259	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>3</sub>	-H	-H	-SCH <sub>3</sub>	-H	-H	510

【0382】

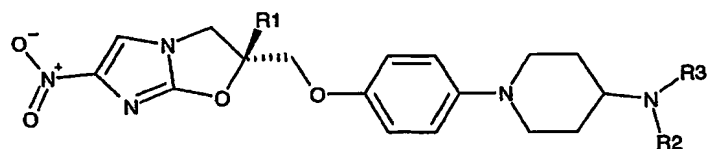
【表 27】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
260	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-H	498
261	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-H	464
262	-CH <sub>3</sub>	2-ClPhCH <sub>2</sub> -	-H	498
263	-CH <sub>3</sub>	3-ClPhCH <sub>2</sub> -	-H	498
264	-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	492
265	-CH <sub>3</sub>	3,4,5-(CH <sub>3</sub> O) <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	568
266	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	535
267	-CH <sub>3</sub>	4-CH <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-H	494
268	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	512
269	-CH <sub>3</sub>	4-FPhCH <sub>2</sub> -	-H	482
270	-CH <sub>3</sub>	3,4-(CH <sub>3</sub> O) <sub>2</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-H	524
271	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	490
272	-CH <sub>3</sub>	(C <sub>2</sub> H <sub>5</sub> ) <sub>2</sub> N(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	501
273	-CH <sub>3</sub>	-cyclo-C <sub>8</sub> H <sub>15</sub>	-H	484
274	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> -	-H	512
275	-CH <sub>3</sub>	-CH <sub>2</sub> -cyclo-C <sub>6</sub> H <sub>11</sub>	-H	470

【0383】

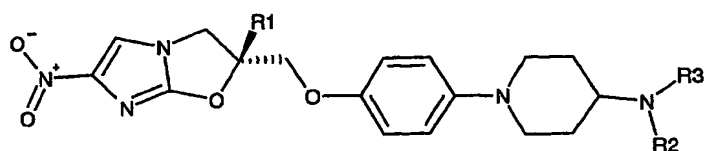
【表 28】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
276	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	522
277	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	493
278	-CH <sub>3</sub>		-H	454
279	-CH <sub>3</sub>		-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	493
280	-CH <sub>3</sub>		-H	644

【0384】

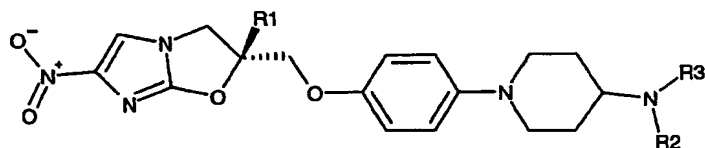
【表 29】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
281	-CH <sub>3</sub>		-H	624
282	-CH <sub>3</sub>		-H	500
283	-CH <sub>3</sub>		-H	600
284	-CH <sub>3</sub>		-H	547

【0385】

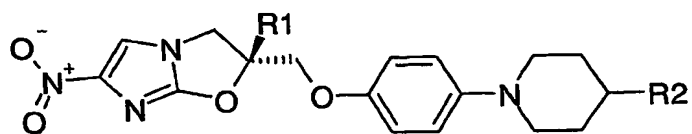
【表 30】



実施例	R1	R2	R3	MS(M+1)
285	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	514
286	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	614
287	-CH <sub>3</sub>		-CH <sub>3</sub>	561

【0386】

【表 31】



実施例	R1	R2	MS(M+1)
288	-CH <sub>3</sub>		490
289	-CH <sub>3</sub>		553
290	-CH <sub>3</sub>		534
291	-CH <sub>3</sub>		575
292	-CH <sub>3</sub>		485
293	-CH <sub>3</sub>		539
294	-CH <sub>3</sub>		577

【0387】

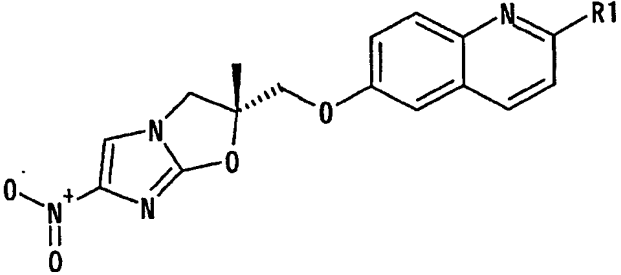


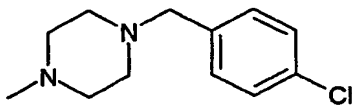
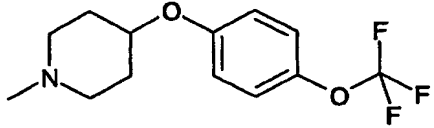
【表 3 2】

			MS(M+1)
実施例	R1	R2	
295	-CH <sub>3</sub>		632
296	-CH <sub>3</sub>		618
297	-CH <sub>3</sub>		566
298	-CH <sub>3</sub>		560
299	-CH <sub>3</sub>		561
300	-CH <sub>3</sub>		581

【0388】

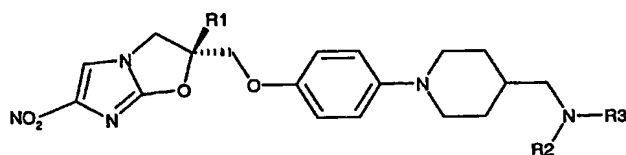
【表 33】



実施例	R1	mp(°C)
301		218.1 - 219.1
302		199.6 - 200.1

【0389】

【表 3 4】



実施例	R1	R2	R3	mp(°C) or <sup>1</sup> H NMR
303	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-COCH <sub>3</sub>	148.6 - 149.1
304	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	116.8 - 119.2
305	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-CH <sub>3</sub>	135.6 - 140.9
306	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	-CH <sub>3</sub>	141.6 - 146.1
307	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-CH <sub>3</sub>	151.4 - 155.0
308	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-COCH <sub>3</sub>	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.29-1.51(2H, brn), 1.67-1.89(6H, brn), 2.13(1.5H, s), 2.20(1.5H, s), 2.46-2.72(2H, brn), 3.12-3.23(1H, brn), 3.27-3.36(1H, brn), 3.44-3.63(2H, brn), 3.96-4.10(2H, brn), 4.10-4.26(1H, brn), 4.49(1H, d, J=10.15Hz), 4.58(1H, s), 4.63(1H, s), 6.63-6.99(4H, brn), 7.12-7.30(4H, m), 7.56(1H, s)
309	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPh-	-H	181.9 - 182.5
310	-CH <sub>3</sub>	4-ClPh-	-H	177.6 - 179.1
311	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph-	-H	164.7 - 165.8
312	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	163.9 - 165.2
313	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	180.5 - 180.8
314	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	169.5 - 170.6
315	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-CH <sub>3</sub>	166.7 - 167.5
316	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	-H	163.9 - 167.6
317	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	-H	163.8 - 166.3
318	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	-H	157.0 - 160.8
319	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> OPhCH <sub>2</sub> -	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.29-1.56(11H, brn), 1.60-1.84(6H, m), 2.46-2.66(2H, brn), 3.00-3.24(2H, brn), 3.44-3.57(2H, brn), 3.97-4.08(2H, m), 4.17(1H, d, J=10.12Hz), 4.35-4.55(3H, m), 6.70-6.80(2H, m), 6.81-6.95(2H, m), 7.12-7.20(2H, m), 7.20-7.32(2H, m), 7.50(1H, s)
320	-CH <sub>3</sub>	4-ClPhCH <sub>2</sub> -	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.29-1.54(11H, brn), 1.60-1.84(6H, m), 2.48-2.66(2H, brn), 3.00-3.22(2H, brn), 3.51(2H, d, J=12.07Hz), 3.96-4.08(2H, m), 4.17(1H, d, J=10.10Hz), 4.34-4.46(2H, brn), 4.49(1H, d, J=10.10Hz), 6.76(2H, d, J=8.97Hz), 6.81-6.93(2H, brn), 7.07-7.21(2H, brn), 7.29(2H, d, J=8.29Hz), 7.55(1H, s)
321	-CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> PhCH <sub>2</sub> -	(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub> COCO-	<sup>1</sup> H NMR (CDCl <sub>3</sub> ) δ 1.31-1.57(11H, brn), 1.61-1.88(6H, m), 2.45-2.72(2H, brn), 3.03-3.28(2H, brn), 3.52(2H, d, J=12.05Hz), 3.96-4.08(2H, m), 4.17(1H, d, J=10.15Hz), 4.41-4.51(3H, m), 6.76(2H, d, J=8.95Hz), 6.83-6.96(2H, brn), 7.26-7.42(2H, brn), 7.55(1H, s), 7.59(2H, d, J=7.95Hz)

## 【0390】

## 試験例 1

抗菌試験 (寒天平板希釈法)

実施例 129 で得られた 2, 3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ [2, 1-b] オキサゾール化合物について、結核菌属 (*M. tuberculosis* H37Rv) に対する最小発育阻止濃度を、7H11 培地 (BBL 社製) を用いて求めた。上記菌株は、予め 7H9 培地 (BBL 社製) で培養し、生菌数を算出し、-80℃で凍結保存した菌液を使用し、最終生菌数を約 10<sup>6</sup> CFU/ml に調製しておいた。このように調製した菌液を、試験化合物含有の

7H11 寒天培地に  $5 \mu\text{l}$  接種し、 $37^\circ\text{C}$  で 14 日間培養した後、最小発育阻止濃度を測定するための試験に供した。

【0391】

M. tuberculosis H37Rv に対する最小発育阻止濃度は、 $0.0015 \mu\text{g/ml}$  であった。

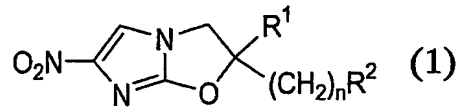
## 【書類名】 要約書

## 【要約】

【課題】 本発明は、結核菌、多剤耐性結核菌及び非定型抗酸菌に対して優れた殺菌作用を有する化合物を提供することを課題とする。

【解決手段】 本発明は、一般式（1）

## 【化1】



[式中、R<sup>1</sup>は、水素原子又はC 1～6 アルキル基を示す。nは、0～6の整数を示す。R<sup>2</sup>は、ベンゾチアゾリルオキシ基；キノリルオキシ基；ピリジルオキシ基等を示す。]で表される2，3-ジヒドロ-6-ニトロイミダゾ[2，1-b]オキサゾール化合物、それらの光学活性体又はそれらの薬理学的に許容される塩を提供する。

【選択図】 なし

【書類名】 手続補正書  
【提出日】 平成16年 3月 3日  
【あて先】 特許庁長官殿  
【事件の表示】  
【出願番号】 特願2003-373206  
【補正をする者】  
【識別番号】 000206956  
【氏名又は名称】 大塚製薬株式会社  
【代理人】  
【識別番号】 100065215  
【弁理士】  
【氏名又は名称】 三枝 英二  
【電話番号】 06-6203-0941  
【手続補正1】  
【補正対象書類名】 特許願  
【補正対象項目名】 発明者  
【補正方法】 変更  
【補正の内容】  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県徳島市城東町一丁目2-35  
【氏名】 壺内 英継  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県板野郡北島町北村字三町地33-15  
【氏名】 佐々木 博文  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県徳島市名東町三丁目89-4  
【氏名】 糸谷 元宏  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県徳島市川内町加賀須野463-30 今切寮E-312  
【氏名】 原口 佳和  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県板野郡松茂町広島字北川向二ノ越147-13  
【氏名】 宮村 伸  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県鳴門市鳴門町高島北字418  
【氏名】 松本 真  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県鳴門市撫養町南浜字東浜527-1 ダイアパレス鳴門1401  
【氏名】 橋詰 博之  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県徳島市川内町沖島422-1 グラン川内タワー310  
【氏名】 富重 辰夫  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県徳島市北田宮2丁目9-6-306  
【氏名】 川崎 昌則  
【発明者】  
【住所又は居所】 徳島県徳島市川内町沖島422-1 1304号  
【氏名】 大黒 絹枝  
【発明者】

【住所又は居所】 徳島県徳島市東新町 2 丁目 2 0 番地 7 0 4  
【氏名】 住田 卓美

特願 2003-373206

出願人履歴情報

識別番号

[000206956]

1. 変更新月日

1990年 8月27日

[変更理由]

新規登録

住所

東京都千代田区神田司町2丁目9番地

氏名

大塚製薬株式会社



# Document made available under the Patent Cooperation Treaty (PCT)

International application number: PCT/JP04/016492

International filing date: 29 October 2004 (29.10.2004)

Document type: Certified copy of priority document

Document details: Country/Office: JP  
Number: 2003-373206  
Filing date: 31 October 2003 (31.10.2003)

Date of receipt at the International Bureau: 17 February 2005 (17.02.2005)

Remark: Priority document submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b)



World Intellectual Property Organization (WIPO) - Geneva, Switzerland  
Organisation Mondiale de la Propriété Intellectuelle (OMPI) - Genève, Suisse